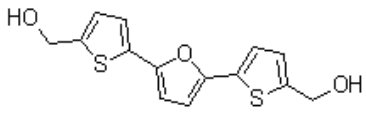


RITA (NSC 652287)

产品编号: MB4076
质量标准: >98%
包装规格: 5MG;10MG
产品形式: solid

基本信息

| | | | |
|-----------|--|-------------|---|
| 分子式 | C14H12O3S2 | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 292.37 | | |
| CAS No. | 213261-59-7 | | |
| 储存条件 | -20°C, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性(25°C) | DMSO: 58 mg/mL (198.37 mM) Water Insoluble Ethanol: 8 mg/mL (27.36 mM) | | |
| 注意事项 | 溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。 | | |
| 其他说明 | 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。 | | |

简介: RITA 是一种有效的 p53-HDM-2 相互作用抑制剂, 可与 p53dN 结合, 同时能够诱导 DNA-DNA 交联。

别名: NSC 652287; 2-Thiophenemethanol, 5,5'-(2,5-furandiyl)bis

物理性状及指标:

外观:淡黄色至黄色固体

溶解性:DMSO: 58 mg/mL (198.37 mM); Water Insoluble; Ethanol: 8 mg/mL (27.36 mM)

含量:>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

| | | |
|-------------|---|-------------------|
| 产品描述 | RITA (NSC 652287) 诱导 DNA-蛋白质和 DNA-DNA 交联, 检测不到 DNA 单链断裂, 通过靶向作用于 p53, 也抑制 MDM2-p53 相互作用。 | |
| 靶点 | DNA 交联(A498 cells) | DNA 交联 (TK-10 细胞) |
| IC50 | 2 nM | 20 nM |
| 体外研究 | RITA 作用于肿瘤细胞, 显示出不同毒性的高度选择性, 因为细胞质 (S100)组分的累积。RITA 也抑制其他肾脏细胞系, 包括 ACHN 和 UO-31 生长, IC50 分别为 13 μM 和 37 μM。RITA (10 nM) 使细胞周期停滞, 使细胞在 G2-M 期累积, 100 nM 时诱导产生 DNA 碎片和凋亡, 且提高 p53 蛋白水平。RITA (30 nM) 作用于 A498 细胞, 也诱导产生 DNA 蛋白和 DNA-DNA 交联。同时, RITA 对 top1-调节的超螺旋 SV40 DNA 松散没有影响。RITA 显著抑制 HCT116 细胞生长 (97%), 而轻微抑制 HCT116 TP53-/- 细胞生长 (13%)。RITA 作用于表达野生型 p53 的细胞, 比作用于缺乏 p53 或 p53 突变的细胞, 更有效抑制生长。RITA 结合到全长 p53 上, 而不是谷胱甘 | |

| | |
|-------------|---|
| | <p>肽 S-转移酶(GST)蛋白或 HDM-2。RITA 阻断 p53-HDM-2 相互作用和 p53 泛素化。RITA 显著降低与 p53 共沉淀的 HDM-2 的量, 虽然这两种蛋白是上调的。RITA 阻断纯化的 GST-p53 和 6XHis 标记的 His-HDM-2 蛋白相互作用。RITA 通过促进 p53Ser46 磷酸化而诱导凋亡。RITA 诱导 p53 激活, 伴随着磷酸化的 ASK-1, MKK-4 和 c-Jun 的上调。RITA 诱导 JNK 信号的激活。但是, 相反, 通过核磁共振(NMR)的另一个结果显示, RITA 不会阻断 p53 (第 1-312 位残基)和 MDM2 的 N-末端 p53 结合域(第 1-118 位残基)之间复合体的形成, 这很可能是 RITA 的结合需要 p53 的天然构想。</p> |
| 体内研究 | <p>RITA 腹腔注射给药小鼠, 具有良好的耐受性, 按 10 mg/kg 剂量处理 1 个月, 观察不到明显的体重减轻。注射 5 次 0.1 mg/kg RITA 后, 抑制 40% HCT116 肿瘤生长, 而对 HCT116 TP53-/- 肿瘤没有明显影响。按 1 或 10 mg/kg 剂量处理, RITA 显示出强抗肿瘤活性。注射 5 次 1 mg/kg RITA 后, p53 阳性移植瘤的生长率降低 2 倍, 而对 p53-null 移植瘤没有影响。RITA 按 10 mg/kg 剂量处理给药小鼠, 与对照组未处理小鼠相比, HCT116 肿瘤减小 90%。RITA 按野生型 p53-依赖性方式抑制肿瘤生长。</p> |
| 特征 | <p>DNA 交联的诱导剂, 而不是 DNA 嵌入剂。</p> |

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

| | |
|--------|------------|
| MB4077 | NSC 319726 |
| MB4080 | Nutlin-3a |
| MB4081 | Nutlin-3b |
| MB4565 | ReACp53 |

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。RITA 是一种有效的 p53-HDM-2 相互作用抑制剂, 可与 p53dN 结合, 同时能够诱导 DNA-DNA 交联。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

| 体 积 浓度 | 质量 | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
|--------------|----|-----------|------------|------------|
| 1 mM | | 3.4203 mL | 17.1016 mL | 34.2032 mL |
| 5 mM | | 0.6841 mL | 3.4203 mL | 6.8406 mL |
| 10 mM | | 0.3420 mL | 1.7102 mL | 3.4203 mL |
| 50 mM | | 0.0684 mL | 0.3420 mL | 0.6841 mL |

经典实验操作 (仅供参考)

| | |
|-------------|---|
| 细胞实验 | <p>Cell lines: A-498, TK-10, ACHN 和 UO-31 细胞 Concentrations: 0.1 nM - 1 mM, 10 mM 储存于 DMSO Incubation Time: 48 小时 Method: 使用 XTT 实验测定细胞对 RITA (0.1 nM - 1 mM)的敏感性。细胞按每孔 1500 个细胞接种在 96 孔平地板上, 在 37°C 下含 5% CO₂ /95% 空气的湿润环境下温育 24 小时。每孔中加入溶于 DMSO 的梯度浓度 RITA, 加入 RITA48 小时后, 测定敏感度。</p> |
|-------------|---|

| | |
|-------------|---|
| 动物实验 | <p>Animal Models: 携带 HCT116 或 HCT116 TP53^{-/-} 移植瘤的 SCID 小鼠</p> <p>Formulation: PBS</p> <p>Dosages: 0.1 mg/kg, 1 mg/kg 或 10 mg/kg</p> <p>Administration: 静脉注射或腹腔注射</p> |
|-------------|---|

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

| 物种 | 体重(KG) | 体表面积(M2) | Km 系数 |
|----|--------|----------|-------|
| 狒狒 | 12 | 0.6 | 20 |
| 狗 | 10 | 0.5 | 20 |
| 猴 | 3 | 0.24 | 12 |
| 兔 | 1.8 | 0.15 | 12 |
| 豚鼠 | 0.4 | 0.05 | 8 |
| 大鼠 | 0.15 | 0.025 | 6 |
| 仓鼠 | 0.08 | 0.02 | 5 |
| 小鼠 | 0.02 | 0.007 | 3 |

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

| 标示重量范围 | 误差范围 |
|----------|-------|
| 1-20MG | 0.1MG |
| 50-500MG | 1MG |
| >1G | 3-5MG |

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。