

Nutlin-3a

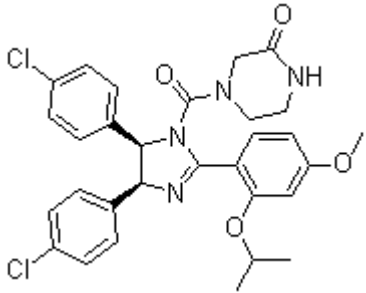
产品编号: MB4080

质量标准: >98%, 抑制 p53/MDM2 相互作用

包装规格: 5MG;25MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C30H30Cl2N4O4	结 构 式	
分子量	581.49		
CAS No.	675576-98-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 100 mg/mL (171.97 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 100 mg/mL (171.97 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: Nutlin 3a 是 Nutlin-3 的活性异构体, 抑制 p53/MDM2 相互作用, 稳定 p53 蛋白, 因此诱导细胞周期停滞和细胞凋亡。

别名: Nutlin-3a chiral; 2-Piperazinone, 4-[[[(4S,5R)-4,5-bis(4-chlorophenyl)-4,5-dihydro-2-[4-methoxy-2-(1-methylethoxy)phenyl]-1H-imidazol-1-yl]carbonyl]-

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 100 mg/mL (171.97 mM); Water : Insoluble; Ethanol : 100 mg/mL (171.97 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	Nutlin-3a 是 Nutlin-3 的活性对映体, 抑制 p53/MDM2 相互作用, 无细胞试验中 IC50 为 90 nM。
特性	高度选择性的 MDM2 抑制剂与对 MDMX 低得多的效果。对含野生型 p53 的肿瘤最有效。
靶点	p53/MDM2 interaction (Cell-free assay) 90 nM
体外研究	Nutlin-3α 从 MDM2 蛋白的结合口袋置换 p53, 由此将 p53 从抑制和蛋白酶体降解状态释放出来, 从而导致诱导其下游靶点, 细胞周期停滞和细胞凋亡。七天孵育 10 μM nutlin-3a 导致了 NIH3T3 细胞的生长抑制达 90%以上。Nutlin-3α 稳定并激活 p53 基因, 以剂量依赖性的方式诱导 p21 的

	表达。Nutlin-3A 有效地减少 S 期细胞至 0.2-2%，并增加了 G1-和 G2/M 期细胞。在 40 小时后，Nutlin-3a 诱导约 60% SJSA-1 和 MHM 细胞的凋亡，而到 60 小时后，凋亡细胞分别达到 85% 和 65%。
体内研究	Nutlin-3α 以剂量依赖性方式抑制异种移植物生长，在最高剂量（200 毫克/千克）时表现大量的肿瘤收缩。Nutlin-3 是 p53 途径在体内的选择性活化剂，并高度有效地抗 SJSA-1 骨肉瘤。有野生型 p53 和 MDM2 基因扩增的肿瘤对 Nutlin-3α 治疗应答最好。

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)

MB4079	Nutlin-3
MB4081	Nutlin-3b

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。Nutlin 3a 是 Nutlin-3 的活性异构体，抑制 p53/MDM2 相互作用，稳定 p53 蛋白，因此诱导细胞周期停滞和细胞凋亡。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.7197 mL	8.5986 mL	17.1972 mL
5 mM		0.3439 mL	1.7197 mL	3.4394 mL
10 mM		0.1720 mL	0.8599 mL	1.7197 mL
50 mM		0.0344 mL	0.1720 mL	0.3439 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	Biacore 研究: 竞争分析是在 Biacore S51 进行。甲系列 S 传感器芯片 CM5 衍生化用于固定一个 PentaHis 抗体来捕获 His-标记的 p53。捕获的水平是 ~200 响应单位 (1 单位响应对应于每毫米 21 pg 的蛋白质)。MDM2 蛋白的浓度被保持恒定在 300 nM。将试验化合物溶解于 10 mM DMSO 中，并进一步稀释使每个 MDM2 测试样品中的浓度系列抑制剂。该试验是在 25 _i 交流的电泳缓冲液 (10 mM HEPES, 0.15M 的 NaCl, 2% DMSO) 中运行。MDM2-p53 在抑制剂存在下的结合的计算方法是在没有抑制剂的结合的百分比，IC 50 是使用微软 EXCE 计算。
细胞实验	Cell lines: OSA, T778, RMS13, U2OS, SaOS-2 Concentrations: ~5 μM Incubation Time: 120 小时 Method: SRB
动物实验	Animal Models: SJSA-1 移植体 Formulation: 1% Klucel, 0.1% Tween 80 Dosages: 50, 100, 200 毫克/千克 每天两次 Administration: 口服

【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。