

JNJ 26854165 ; JNJ-26854165 (Serdemetan)

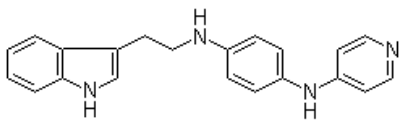
产品编号 : MB5143

质量标准 : >98%

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C21H20N4	结 构 式	
分子量	328.41		
CAS No.	881202-45-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 66 mg/mL (200.96 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol : 2 mg/mL (6.08 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 : Serdemetan(JNJ-26854165)是 HDM2 泛素连接酶拮抗剂, 能诱导 p53 野生型细胞的早期凋亡。

别名 : JNJ-26854165 ; 1,4-Benzenediamine, N1-[2-(1H-indol-3-yl)ethyl]-N4-4-pyridinyl

物理性状及指标 :

外观 :淡棕色至棕色固体

溶解性 :DMSO : 66 mg/mL (200.96 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 2 mg/mL (6.08 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	JNJ-26854165 (Serdemetan)是一种 HDM2 泛素连接酶拮抗剂, 作用于 p53 野生型细胞, 诱导早期凋亡, 在缺乏功能性 p53 的细胞中, 抑制细胞增殖而延迟细胞凋亡。		
特性	JNJ 26854165 是口服生物有效性的, 小分子 HDM2 拮抗剂, 具有有效的抗肿瘤活性。		
靶点	p53 (Cell-free assay)	HDM2 (Cell-free assay)	Mdm2 (Cell-free assay)

体外研究	JNJ-26854165 是新型激活 p53 的色胺衍生物，作为 HDM2 泛素连接酶拮抗剂。JNJ-26854165 作用于白血病细胞系，抑制细胞生长，且诱导凋亡，作用于 OCI-AML-3, MOLM-13, NALM-6 和 REH 细胞 72 小时后，IC50 值分别为 0.24, 0.33, 0.32 和 0.44 μ M。此外，JNJ-26854165 作用于 p53 突变的细胞，加速蛋白酶调节的 p21 降解和抗 p53 对 p21 的转录诱导，诱导 S 期延迟，且上调 E2F1 表达，导致 S 期细胞优先凋亡。JNJ-26854165 是口服 MDM2 抑制剂，可以抑制 MDM2-p53 复合体与蛋白酶的相互作用，且通过与 MDM2 的 RING 域结合提高 p53 水平。最新研究显示 JNJ-26854165 作用于四种人类癌细胞系：H460, A549, p53-WT-HCT116, 和 p53-null-HCT116，抑制无性繁殖生存。
体内研究	JNJ-26854165 按 20 mg/kg 剂量口服饲喂于三十六分之十七(47%)实体移植瘤和七分之五(71%) ALL 移植瘤，持续 5 天，重复进行 6 周，导致 EFS 分布出现明显区别。

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

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。

Serdemetan(JNJ-26854165)是 HDM2 泛素连接酶拮抗剂，能诱导 p53 野生型细胞的早期凋亡。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 \ 质 量 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.0450 mL	15.2249 mL	30.4497 mL
5 mM	0.6090 mL	3.0450 mL	6.0899 mL
10 mM	0.3045 mL	1.5225 mL	3.0450 mL
50 mM	0.0609 mL	0.3045 mL	0.6090 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: OCI-AML-3, MOLM-13, NB4 和 U937 细胞</p> <p>Concentrations: 0 到 10 μM</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 细胞系维持在含 10%热灭活胎牛血清(FCS)的 RPMI 1640 培养基上。急性骨髓性白血病(AML)患者体内得到的 OCI-AML-3, MOLM-13, NB4 和 U937 细胞,慢性髓细胞性白血病(CML)患者体内得到的 K562 细胞,急性成淋巴细胞性白血病(ALL)患者体内得到的 NALM-6, REH, P12-ICHIKAWA 和 PF-382 细胞。OCI-AML-3, MOLM-13, NALM-6 和 REH 细胞具有</p>
-------------	--

	<p>野生型 p53, 然而 NB4,U937,K562,P12-ICHIKAWA 和 PF-382 细胞具有突变型 p53, 获得对数生长期细胞系, 接种, 用 JNJ-26854165 处理。白血病患者体内获得的白血病细胞中获得肝素外周血或骨髓样本。通过密度梯度离心纯化单核细胞, 非黏着细胞悬浮在含 10%FCS 的 RPMI 1640 培养基上。正常骨髓衍生的干细胞接种在含 MEM-α 培养基的 12 孔板上, 24 小时后, 加入 AML 细胞。为了研究骨髓干细胞作用于原代白血病细胞的效果, 培养 AML 细胞。在 JNJ-26854165 和 AraC 的联合实验中, 用 0, 2, 5 或 10 μM。JNJ-26854165 处理 AML 细胞系。在 OCI-AML-3 细胞中 JNJ-26854165 与 AraC 的浓度比为 1:1, 在其他细胞中为 10:1。两种试剂同时加到细胞中, 培养 48 小时。JNJ-26854165 和 Doxorubicin 联用的实验中, 两种试剂同时加到细胞中, 培养 48 小时。用 0, 25, 50 或 100 nM Doxorubicin 处理细胞 (用 0, 100, 200 或 400 nM Doxorubicin 处理 OCI-AML-3 细胞和原代白血病细胞), Doxorubicin 与 JNJ-26854165 的浓度比为 1:10 (在 OCI-AML-3 细胞和原代白血病细胞中比为 1:25)。通过台酚蓝染料重复计数, 测评细胞活力。</p>
<p>动物实验</p>	<p>Animal Models: 皮下注射 kidney/rhabdoid 肿瘤, 肉瘤, 成神经细胞瘤, 和非恶性胶质瘤脑癌的雌性 CB17SC scid-/- 小鼠, 携带神经胶质瘤的 BALB/c nu/nu 小鼠</p> <p>Formulation: JNJ-26854165 溶于 DMSO, 然后用水稀释</p> <p>Dosages: ≤ 20 mg/kg</p> <p>Administration: 口服处理</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。