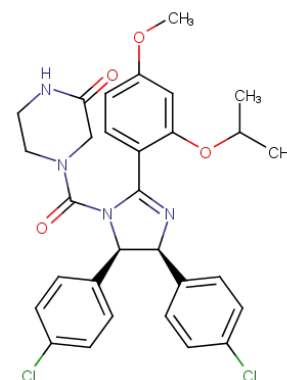


Catalog Number: CM05040

产品信息

Catalog Number:
CM05040CAS号:
675576-98-4分子式:
 $C_{30}H_{30}Cl_2N_4O_4$ 主要靶点:
Apoptosis|E1/E2/E3
Enzyme|Autophagy主要通路:
自噬|泛素化|凋亡分子量:
581.49溶解度:
Ethanol:58.2 mg/mL (100
mM),DMSO:58.2 mg/mL (100 mM)

靶点活性

p53/MDM2 interaction:90 nM

体外活性

Nutlin-3是体内p53途径的选择性激活剂,对SJS-1骨肉瘤肿瘤具有高度的有效性.Nutlin-3 α 以剂量依赖性方式抑制异种移植植物生长,其中最高剂量(200 mg/kg)表现出显著的肿瘤缩小.Nutlin-3 α 治疗对有野生型p53和MDM2基因扩增的肿瘤效果最佳。

体内活性

用10 μ M Nutlin-3a孵育7天导致NIH3T3细胞生长抑制> 90%。Nutlin-3 α 稳定并激活p53基因,剂量依赖性诱导p21的表达。Nutlin-3a取代MDM2结合口袋中的p53,从而释放p53抑制和蛋白酶体降解,导致诱导其下游靶点,细胞周期停滞和凋亡。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。Nutlin-3a诱导约60%的SJS-1和MHM细胞在40小时后发生凋亡,其在60小时后分别进一步增加(分别为85%和65%)。

细胞实验

SRB(Only for Reference)

描述

Nutlin-3a, the active enantiomer of Nutlin-3, inhibits MDM2-p53 interactions and stabilizes the p53 protein.

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 2 years