

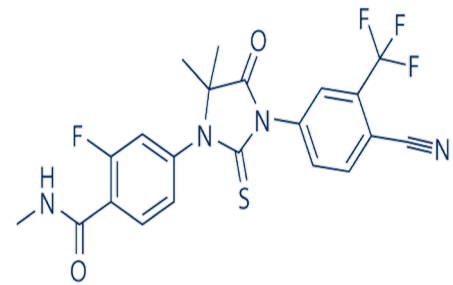
Enzalutamide (MDV3100) (AR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0074-10mM	Enzalutamide (MDV3100) (AR 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0074-5mg	Enzalutamide (MDV3100) (AR 抑制剂)	5mg
SC0074-25mg	Enzalutamide (MDV3100) (AR 抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[3-[4-cyano-3-(trifluoromethyl)phenyl]-5,5-dimethyl-4-oxo-2-sulfanylideneimidazolidin-1-yl]-2-fluoro-N-methylbenzamide
简称	Enzalutamide
别名	MDV 3100, MDV3100, MDV-3100
中文名	恩杂鲁胺
化学式	C ₂₁ H ₁₆ F ₄ N ₄ O ₂ S
分子量	464.44
CAS号	915087-33-1
纯度	99.6%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 92mg/ml warmed; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.08ml DMSO, 或者每4.64mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0074-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Enzalutamide(MDV3100)是一种androgen-receptor(AR)拮抗剂, 在LNCaP细胞中IC ₅₀ 为36nM。				
信号通路	Endocrinology & Hormones				
靶点	Androgen Receptor	—	—	—	—
IC ₅₀	36nM	—	—	—	—
体外研究	Enzalutamide是雄激素受体(AR)拮抗剂, IC ₅₀ 为36nM。在加入16β-[¹⁸ F]氟-5α-DHT (18-FDHT)的竞争性实验中发现作用于AR时 Enzalutamide比 bicalutamide 具有更高的亲和力。而 Enzalutamide 作用于LNCaP/AR(AR-过量表达)前列腺细胞时没有效果。在亲本LNCaP细胞中, Enzalutamide抑制前列腺特异性抗原(PSA)和跨膜丝氨酸蛋白酶2(TMPS2)的产生, 及抑制它们与合成的雄激素R1881结合。Enzalutamide可抑制突变AR蛋白(W741C, 741位上的Trp突变为Cys)的翻译活性。MDV310也阻断核转位和配位受体复合物招募辅激活因子。				
体内研究	Enzalutamide处理携带LNCaP/AR移植瘤的阉割雄鼠, 按鼠体重, 每千克处理10mg MDV310, 可诱导肿瘤的明显退化。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	在抗激素的前列腺癌细胞系中通过人工AR反应报告分子系统测定Enzalutamide。在这个系统中, 前列腺癌LNCaP细胞稳定表达AR, 表达的AR水平比体内自身产生的AR水平高5倍多。外界合成的AR和体内自身产生的AR有着相似的特性, 都能稳定与合成的雄激素R1881作用。AR过量表达的细胞也能含有AR反应报告分子, 这些细胞的报告分子活性显示抗激素前列腺癌的特性。在含100pM R1881时测定Enzalutamide的抗性。LNCaP细胞供养在含有10%胎牛血清的Iscove's培养基中。在用Enzalutamide处理的前两天, 细胞在含活性炭处理的胎牛血清(CS-FBS)Iscove's培养基中生长, 用于除去雄激素。细胞在培养基上分裂和生长, 培养基含有10% CS-FBS、100pM R1881及增加浓度的Enzalutamide。温育两天后, 测定报告分子活性。

细胞实验	
细胞系	LNCaP或LNCaP/AR细胞
浓度	10 μ M左右
处理时间	1-4天
方法	用DMSO稀释Enzalutamide。LNCaP或LNCaP/AR细胞(10 ⁴ 细胞/每孔)缺乏雄激素，在含有5-10%活性炭处理的血清培养基上生长3到5天。然后在5-10%活性炭处理的血清培养基中加入不同浓度(1到10000nM)Enzalutamide处理细胞。

动物实验	
动物模型	雄激素非依赖性LNCaP/HR移植瘤雄性SCID鼠
配制	Enzalutamide在1%羧甲基纤维素、0.1% Tween-80及5% DMSO中配制成
剂量	10mg/kg
给药方式	每天饲喂处理

➤ 参考文献:

1. Tran C, et al. Science. 2009; 324 (5928):787-790.
2. Scher HI, et al. Lancet. 2010; 375(9724):1437-1446.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0074-10mM	Enzalutamide (MDV3100) (AR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0074-5mg	Enzalutamide (MDV3100) (AR抑制剂)	5mg
SC0074-25mg	Enzalutamide (MDV3100) (AR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月内有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2016.12.12