

JNJ 26854165

产品信息

产品名称	产品编号	规格
JNJ 26854165	53724ES08	5 mg
	53724ES25	25 mg

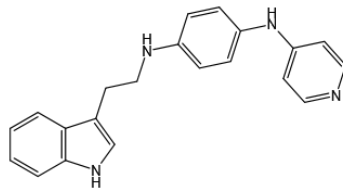
产品描述

JNJ 26854165 (JNJ26854165, Serdemetan), 又称谢尔德梅坦, 是一种可口服 HDM2 泛素连接酶拮抗剂, 通过抑制 HDM2-目的蛋白复合体与蛋白酶体的相互作用, 抑制目的蛋白降解, 具有抗肿瘤活性。JNJ 26854165 可以诱导 p53 野生型细胞的早期凋亡。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	JNJ 26854165, JNJ26854165, Serdemetan
中文名称 (Chinese Name)	谢尔德梅坦
靶点 (Target)	HDM2
通路 (Pathway)	Apoptosis--MDM-2/p53
CAS 号 (CAS NO.)	881202-45-5
分子式 (Formula)	C ₂₁ H ₂₀ N ₄
分子量 (Molecular Weight)	328.41
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

JNJ-26854165 作用于白血病细胞系, 抑制细胞生长, 诱导细胞凋亡; 作用于 OCI-AML-3、MOLM-13、NALM-6 和 REH 细胞 72 h, IC_{50} 值分别为 0.24、0.33、0.32 和 0.44 μ M。JNJ-26854165 作用于 p53 突变的细胞, 促进 p21 蛋白酶体降解和抗 p53 对 p21 的转录诱导, 导致 S 期延迟, 且上调 E2F1 表达, 导致 S 期细胞优先凋亡。^[1] JNJ-26854165 作用于 H460、A549、p53-WT-HCT116 和 p53-null-HCT116 细胞系, 抑制增殖。^[3]

(二) 动物实验 (体内实验)

在多种移植瘤小鼠模型中, 口服 JNJ-26854165 (≤ 20 mg/kg), 在 37 个实体瘤中的 18 个和 7 个可评估的 ALL 异种移植瘤中的 5 个中, EFS 分布出现明显区别。^[4]

参考文献

- [1]. Kojima K, Burks JK, Arts J, Andreeff M. The novel tryptamine derivative JNJ-26854165 induces wild-type p53- and E2F1-mediated apoptosis in acute myeloid and lymphoid leukemias. *Mol Cancer Ther.* 2010 Sep;9(9):2545-57.
- [2]. T. Stühmer et al. A first-in-class HDM2-inhibitor (JNJ-26854165) in phase I development shows potent activity against multiple myeloma (MM) cells in vitro and ex vivo *Journal of Clinical Oncology*, 2008 ASCO Annual Meeting Proceedings (Post-Meeting Edition). Vol 26, No 15S (May 20 Supplement), 2008: 14694.
- [3]. Chagari C, et al. Preclinical assessment of JNJ-26854165 (Serdemetan), a novel tryptamine compound with radiosensitizing activity in vitro and in tumor xenografts. *Cancer Lett.* 2011 Dec 22;312(2):209-18.
- [4]. Smith MA, et al. Initial testing of JNJ-26854165 (Serdemetan) by the pediatric preclinical testing program. *Pediatr Blood Cancer.* 2012 Aug;59(2):329-32.