

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	E12060
产品名称:	Elacestrant dihydrochloride

产品简介:

一种具有口服活性的选择性 estrogen receptor (ER) 降解剂 (SERD), 对 ER α 和 ER β 的 IC₅₀ 值分别为 48 和 870 nM。Elacestrant dihydrochloride 还能有效抑制 ER+ 乳腺癌细胞系在体内外的生长。

靶点: IC₅₀: 48 nM (ER α), 870 nM (ER β)

体外研究:

Elacestrant dihydrochloride (RAD1901; 0.5 nM–10 μ M; 48 h) 在 MCF-7 细胞中, 以浓度依赖的方式抑制 ER α 的表达 (EC₅₀= 0.6 nM)。

Elacestrant dihydrochloride (0–1 μ M; 48 h) 以浓度依赖的方式对雌二醇 (E2) 刺激的 ER 阳性 MCF-7 细胞显示出抗增殖活性 (EC₅₀= 4 pM)。

Elacestrant dihydrochloride (0–1 μ M; 24 or 48 h) 在 MCF7, T47D 和 HCC1428 细胞中, 抑制雌激素受体蛋白的表达。

Elacestrant dihydrochloride (0.01, 0.1, 1.0 μ M) 能降低 MCF7 和 T47D 细胞系中孕酮受体 (PR; 一种 ER 靶基因) 的表达。

体内研究:

Elacestrant dihydrochloride (0.3–120 mg/kg; p.o.; single daily for 40 days) 在大鼠中以剂量依赖的方式拮抗 E2 介导的子宫刺激。

Elacestrant dihydrochloride (30, 60 mg/kg; p.o.; single daily for 4 weeks) 在小鼠体内完全抑制肿瘤生长。

Elacestrant dihydrochloride 在停药后, 还能持续四周抑制肿瘤生长。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 100.0 (Max Conc. mg/mL); 188.13 (Max Conc. mM)			
Water: 50.0 (Max Conc. mg/mL); 94.06 (Max Conc. mM)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	1.8813 mL	9.4063 mL	18.8126 mL
5 mM	0.3763 mL	1.8813 mL	3.7625 mL
10 mM	0.1881 mL	0.9406 mL	1.8813 mL
储备液的保存方式: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。			
二: 体内实验			
1、请依序添加每种溶剂: 5% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→50% Saline			
Solubility: $\geq$ 2.87 mg/mL (5.40 mM); 澄清溶液			



2、请依序添加每种溶剂： 5% DMSO→95% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.87 mg/mL (5.40 mM); 澄清溶液
3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.70 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80，混合均匀；然后 再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。
4、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.70 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。
5、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.70 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中，混合均匀。
6、请依序添加每种溶剂： 1% DMSO→99% Saline Solubility: ≥ 0.57 mg/mL (1.07 mM); 澄清溶液
注：工作液建议您现用现配，当天使用。
<1mg/ml 表示微溶或不溶。 普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

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、以上信息仅做参考交流之用。

储存：2-8℃ 密封干燥

