

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	F10014
产品名称:	氟维司群

产品简介:

一种雌激素受体 GPR30 抑制剂和激活剂。ICI 182780 is a high affinity estrogen receptor antagonist ($IC_{50} = 0.29 \text{ nM}$), devoid of any partial agonism in vitro and ICI 182,780 is also a high affinity agonist at the membrane estrogen receptor, GPR30.

靶点: IC_{50} : 9.4 nM (Estrogen Receptor)

体外研究:

Fulvestrant (ICI 182780; ZD 9238; ZM 182780) 是一种有效且特异性的雌激素作用抑制剂, 在人类乳腺癌细胞和动物模型中均表现出优异的生长抑制作用。Fulvestrant 抑制 MCF-7 人乳腺癌细胞的生长, IC_{50} 为 0.29 nM。

Fulvestrant 的相对结合亲和力为 0.89。Fulvestrant 具有显著增强的抗雌激素效力并保留纯雌激素拮抗剂活性。Fulvestrant 是第一种新型内分泌处理药物——雌激素受体(ER) 拮抗剂, 可下调 ER。用 1 μM ICI 47699 处理 MCF-7 细胞对 ER α 的表达没有影响, 而 100 nM Fulvestrant 完全抑制 ER α 表达。

体内研究:

Fulvestrant (ICI 182,780) 单独给药时, 肠胃外 (s.c.) 在未成熟的雌性大鼠中没有促子宫活性。

Fulvestrant (0.5 mg/kg/day s.c) 显示出对雌激素作用的完全拮抗作用。

Fulvestrant 口服给药 (5 mg/kg/day) 在性质上与皮下给药相似。在两种人类乳腺癌裸鼠模型中。在其中一个模型中, Fulvestrant (5 mg) 在单次注射后完全阻断 MCF-7 肿瘤异种移植物的生长至少 4 周。在对携带 MCF-7 异种移植物的裸鼠进行的其他研究中, 与使用 ICI 47699 治疗观察到的情况相比, Fulvestrant 抑制已建立肿瘤的生长时间是其两倍, 并且肿瘤生长延迟的程度更大。

Fulvestrant 在第 40 天表现出 88% 的肿瘤生长抑制 (TGI)。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

溶于 DMSO (121 mg/ml)、氯仿、水 (<1 mg/ml) 和乙醇 (50 mM)。

浓度	质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM		1.6481 mL	8.2404 mL	16.4807 mL
5 mM		0.3296 mL	1.6481 mL	3.2961 mL
10 mM		0.1648 mL	0.8240 mL	1.6481 mL

储备液的保存方式: -80°C , 2 years; -20°C , 1 year。

二: 体内实验



1、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% (20% SBE-β-CD in Saline)

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.12 mM); 悬浊液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。

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。

2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline

Solubility: 2.08 mg/mL (3.43 mM); 悬浊液; 超声助溶

此方案可获得 2.08 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 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。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.43 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

4、请依序添加每种溶剂： 15% Solutol HS 15→ 10% Cremophor EL→35% PEG400→40% Water

Solubility: 2.5 mg/mL (4.12 mM); 悬浊液; 超声助溶

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。

三、细胞实验

细胞系: MCF-7 乳腺癌细胞

浓度: 2.9 nM

处理时间: 5 天

方法: MCF-7 细胞培养在多孔板中 (24 孔, 按 4×10^4 密度为接种), 孔中含基本必需培养基, 培养基中包含酚红, 胰岛素 (10 μ g/mL), 和 5% 活性炭处理的胎牛血清, 不含额外的雌二醇。接种 2 天后, 在新鲜的培养基中加入 Fulvestrant 和/或雌二醇。培养持续 5 天, 且进一步改变培养基, 通过在实验处理开始和结束测量全部细胞蛋白, 且与只用乙醇 (0.1%) 处理的对照组进行比较后, 测评生长状况。

四、动物实验

动物模型: 携带人类乳腺癌移植瘤 MCF-7 的裸鼠

剂量: 5 mg

给药处理: 皮下注射

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℃

