

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	F70416
产品名称:	氟他胺

产品简介:

抗雄激素化合物，能与其活性代谢物一起与雄激素受体相结合， K_i 为 55 nM，可作用于前列腺癌。

Flutamide, also known as SCH13521, is a toluidine derivative and nonsteroidal antiandrogen that is structurally related to bicalutamide and nilutamide. Flutamide and its more potent active metabolite 2-hydroxyflutamide competitively block dihydrotestosterone binding at androgen receptors, forming inactive complexes which cannot translocate into the cell nucleus. Formation of inactive receptors inhibits androgen-dependent DNA and protein synthesis, resulting in tumor cell growth arrest or transient tumor regression. Check for active clinical trials or closed clinical trials using this agent. (NCI Thesaurus).

体外研究:

Flutamide 的活性代谢物是 Flutamide-OH。两者均直接结合大鼠垂体前叶雄激素受体($K_i=55$ nM)。

Flutamide 不影响培养的小鼠乳腺癌 Shionogi SC-1 15 细胞的雄激素敏感克隆的增殖，仅显示抗雄激素作用，但不显示雄激素作用。

Flutamide 与 Leuprolides 一起使用可抑制前列腺癌。

Flutamide 对 PC3 和 LNCap 具有细胞毒活性 (IC_{50} s 分别为 20 μ M 和 12 μ M)。Flutamide (10 μ M, 5 μ M; 48 h) 诱导 PC3 和 LNCap 细胞凋亡，减少细胞迁移和定植。

Flutamide 还下调细胞中 KLK2 和 EMT 通路基因的表达。

体内研究:

Flutamide 导致大鼠腹侧前列腺重量从 319 mg 显著减少至 245 mg。Flutamide 和 LHRH 激动剂的组合可产生叠加效应，前列腺重量降至 101 mg，前列腺 ODC 活性显著下降。

Flutamide (12.5-50 mg/kg; 皮下注射; 每天一次, 连续 3 天) 缓解热应激小鼠的中暑。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

DMSO: 溶于 DMSO (≥ 100 mg/mL)

浓度	质量	1mg	5mg	10mg
	溶液体积			
1 mM		3.6204 mL	18.1022 mL	36.2043 mL
5 mM		0.7241 mL	3.6204 mL	7.2409 mL
10 mM		0.3620 mL	1.8102 mL	3.6204 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→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.05 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。

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

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.05 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。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.05 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。

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、激酶实验

雄激素受体试验：

100 μ L 胞浆和 100 μ L 饱和浓度的 [3 H]T 含有或者不含有逐渐增加浓度的无标记 T，DHT，flutamide (FLU) 或 flutamide-OH (FLU-OH) 在 0-4 $^{\circ}$ C 孵育 18 h。孵育结束时，加入 200 μ L 葡聚糖被覆活性炭(1 %活性炭，0.1%葡聚糖 T-70，0.1% 凝胶，1.5 mM EDTA 以及 50 mM Tris (pH 7.4)) 在 0-4 $^{\circ}$ C 孵育 15 分钟，2300 $\times$ g 离心 15 分钟以分离自由的和结合的 T。350 μ L 上清转移到含有 10ml 水溶液的计数器管中，用 Beckman LS 330 计数器计数。

四、细胞实验

细胞系：雄激素敏感的 Shionogi 细胞

浓度：~1 μ M

处理时间：40 天

方法：Flutamide 影响培养基中小鼠乳腺癌 Shionogi 细胞的雄激素敏感性增殖(SEM-1)的生长。细胞在含有 (MEM + 2% 胎牛血清中萃取的葡聚糖被覆) 和 1 μ M 化合物的培养基中培养 40 天。培养基每两天更换一次。

五、动物实验

动物模型：雄性大鼠

剂量：5 毫克 每天两次，0.25 毫升

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：室温

