

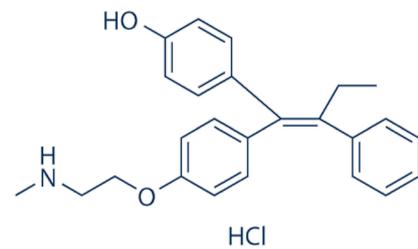
Endoxifen HCl (Estrigen Receptor拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD0011-10mM	Endoxifen HCl (Estrigen Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD0011-5mg	Endoxifen HCl (Estrigen Receptor拮抗剂)	5mg
SD0011-25mg	Endoxifen HCl (Estrigen Receptor拮抗剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[(Z)-1-[4-[2-(methylamino)ethoxy]phenyl]-2-phenylbut-1-enyl]phenol;hydrochloride
简称	Endoxifen HCl
别名	Endoxifen hydrochloride, Z-Endoxifen hydrochloride, NSC750393, NSC-750393, NSC 750393
中文名	N/A
化学式	C ₂₅ H ₂₈ ClNO ₂
分子量	409.95
CAS号	1032008-74-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 74mg/ml; Ethanol 74mg/ml
溶液配制	5mg加入1.22ml DMSO, 或每4.10mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD0011-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Endoxifen HCl, Tamoxifen的活性代谢产物, 是一种有效的选择性estrogen receptor拮抗剂。Phase 2。				
信号通路	Endocrinology & Hormones				
靶点	Estrogen receptor	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	在MCF-7细胞中, Endoxifen表现出抗雌激素作用, 并减少E2诱导的PR表达。Endoxifen也会阻断ER-α转录活性, 并抑制雌激素诱导的乳腺癌细胞增殖。在MCF7、HS 578T和BT-549细胞中, Endoxifen显著抑制细胞增殖。与tamoxifen相比, Endoxifen对PKC活性表现出4倍的抑制。Endoxifen通过优先与激活态的克隆hERG钾通道相互作用, 抑制hERG流, IC50为1.6μM。				
体内研究	在体内, Endoxifen(8mg/kg)抑制小鼠体内MCF-7人乳腺肿瘤异种移植物的生长, 表现出高于Tamoxifen的疗效。				
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	N/A

细胞实验	
细胞系	MCF7和Ishikawa细胞
浓度	1000nM
处理时间	8天
方法	MCF7和Ishikawa细胞在10%三倍活性炭处理的包含血清的培养基中生长3天。然后细胞以2000细胞/孔的密度接种在96孔组织培养板, 并按照指示每48小时处理一次。使用CellTiter-Glo发光细胞活性试剂盒根据制造商方案第一次处理后, 第8天, 进行细胞增殖试验。

动物实验	
动物模型	负荷MCF-7人乳腺肿瘤异种移植物的老鼠

配制	水
剂量	8mg/kg
给药方式	p.o.

➤ **参考文献:**

- 1.Lim YC, et al. Cancer Chemother Pharmacol. 2005, 55(5), 471-478.
- 2.Wu X, et al. Cancer Res. 2009, 69(5), 1722-1727.
- 3.Ahmad A, et al. Breast Cancer Res Treat. 2010, 122(2), 579-584.
- 4.Ali SM, et al. Bioorg Med Chem Lett. 2010, 20(8), 2665-2667.
- 5.Chae YJ, et al. Eur J Pharmacol. 2015, 752, 1-7.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD0011-10mM	Endoxifen HCl (Estrigen Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD0011-5mg	Endoxifen HCl (Estrigen Receptor拮抗剂)	5mg
SD0011-25mg	Endoxifen HCl (Estrigen Receptor拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 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淀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、体内研究结果或其他相关文献，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的等效剂量转换表请参考如下网页：

<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01