

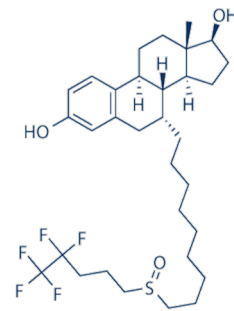
Fulvestrant (ER拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD0002-10mM	Fulvestrant (ER拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD0002-5mg	Fulvestrant (ER拮抗剂)	5mg
SD0002-25mg	Fulvestrant (ER拮抗剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(7R,8R,9S,13S,14S,17S)-13-methyl-7-[9-(4,4,5,5-pentafluoropentylsulfinyl)nonyl]-6,7,8,9,11,12,14,15,16,17-decahydrocyclopenta[a]phenanthrene-3,17-diol
简称	Fulvestrant
别名	Faslodex, ICI 182,780, ICI 182780, ICI-182780, ZM 182780, ZM-182780
中文名	氟维司群
化学式	C ₃₂ H ₄₇ F ₅ O ₃ S
分子量	606.77
CAS号	129453-61-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 100mg/ml
溶液配制	5mg加入0.82ml DMSO, 或每6.07mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD0002-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Fulvestrant是一种Estrogen receptor(ER)拮抗剂, 无细胞试验中IC ₅₀ 为0.094nM。				
信号通路	Endocrinology & Hormones				
靶点	ER	—	—	—	—
IC ₅₀	0.94nM	—	—	—	—
体外研究	Fulvestrant有效抑制ER阳性的MCF-7生长(IC ₅₀ 为0.29nM), 而对ER阴性的BT-20人类乳腺癌细胞的生长没有作用效果。Fulvestrant使细胞在G ₀ /G ₁ 期累积, 也降低了能持续进行DNA合成的细胞比例。Fulvestrant 竞争性地抑制雌二醇与雌激素受体结合。Fulvestrant通过损害受体二聚化和能量依赖型核质转运, 而阻断ER的核定位。由于Fulvestrant-ER复合体的不稳定性, Fulvestrant与ER的结合最终会导致ER蛋白的加速退化。Fulvestrant(10nM) 不仅可降低IGF-IR mRNA水平, 也降低半衰期。100μM Fulvestrant处理MCF-7细胞, 提高TNFR1和TRADD稳态的mRNA水平, 这种作用具有时间依赖性。Fulvestrant作用于LNCaP人类前列腺癌细胞, 可以下调雄激素受体的表达, 也减少雄激素的反应。Fulvestrant也显著降低R1881刺激的生长, 降低70%。Fulvestrant作用于未成熟的小脑神经元, 通过快速激活MAPK, 可以调节有丝分裂和细胞死亡。				
体内研究	Fulvestrant缺乏子宫活性, 与雌二醇联用皮下注射给药未成熟的雌性大鼠, 有效抑制雌二醇的子宫内活性, ED ₅₀ 为0.06mg/kg/day。5mg Fulvestrant悬浮液皮下注射到MCF-7移植瘤中, 完全抑制肿瘤生长。10μM Fulvestrant也有效抑制BrI0人类乳腺癌移植瘤的生长。Fulvestrant (10mg/rat)皮下注射到大鼠前列腺腹侧, 降低雄激素受体的表达, ERK1/2磷酸化和细胞增殖。Fulvestrant作用于鸡胚绒毛尿囊膜还具有抗血管生成的作用效果。				
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	MCF-7乳腺癌细胞
浓度	2.9nM
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。

动物实验	
动物模型	携带人类乳腺癌移植瘤MCF-7的裸鼠
配制	50mg/ml花生油
剂量	5mg
给药方式	皮下注射

➤ **参考文献:**

- 1.Wakeling AE, et al. Cancer Res, 1991, 51(15), 3867-3873.
- 2.Huynh H, et al. Clin Cancer Res, 1996, 2(12), 2037-2042.
- 3.Smolnikar K, et al. Breast Cancer Res Treat, 2000, 63(3), 249-259.
- 4.Bhattacharyya RS, et al. Mol Cancer Ther, 2006, 5(6), 1539-1549.
- 5.Wong JK, et al. J Neurosci, 2003, 23(12), 4984-4995.
- 6.Fernandes SA, et al. Int J Androl, 2011, 34(5 Pt 1), 486-500.
- 7.Gagliardi A, et al. Cancer Res, 1993, 53(3):533-535.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD0002-10mM	Fulvestrant (ER拮抗剂)	10mM \times 0.2ml
SD0002-5mg	Fulvestrant (ER拮抗剂)	5mg
SD0002-25mg	Fulvestrant (ER拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有害, 操作时请小心, 并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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