



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **XCT 790**
CAS 号: **725247-18-7**
产品货号: **S86330**

生物活性:						
Description	XCT-790 是 ERR α 的有效选择性反向激动剂, IC ₅₀ 值为 0.37 μ M。XCT-790 在化疗过程中诱导癌细胞死亡。XCT-790 对 ERR γ 和雌激素受体 ER α 和 ER β 无活性。					
IC50 & Target[1][2]	ERR α 0.37 μ M (IC ₅₀)					
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description		
	CV-1	IC ₅₀	0.37 μ M	Inverse agonist activity at GAL4-fused ERRalpha (unknown origin) transfected in african green monkey CV1 cells after 24 hrs by luciferase reporter gene assay		
	HEK293	IC ₅₀	0.37 μ M	Antagonist activity at ERRalpha LBD expressed in HEK293 cells assessed as Gal4-SRC2 interaction by two hybrid luciferase reporter gene assay		
In Vitro	Xct-790 (0-40 μ M; 48 小时和 72 小时) 以剂量依赖性方式降低 MES-SA、MES-SA/DX5 和 HepG2 细胞的活力[1]。					
	XCT-790 (10 μ M; 24 小时和 48 小时) 降低 HepG2 和 R-HepG2 细胞系中 ERR α 蛋白水平, 并在 48 小时后维持这些降低水平[1]。					
	XCT-790 (10 μ M; 48 小时) 诱导两种细胞系的凋亡, 其中 HepG2 比 R-HepG2 更敏感[1]。					
	Cell Viability Assay[1]					
	Cell Line:	MES-SA, MES-SA/DX5, HepG2 and R-HepG2 cells				
	Concentration:	0 μ M, 5 μ M, 10 μ M, 20 μ M, and 40 μ M				
	Incubation Time:	48 hours and 72 hours				
In Vivo	Result:	The cells proliferation were decreased in a dose-dependent fashion.				
	XCT-790 (XCT790; 4 mg/kg; 静脉注射; 每三天注射; 持续 3 周; BALB/c 小鼠) 在异种移植模型中显著抑制肿瘤生长和血管生成, 诱导细胞凋亡而不降低体重[3]。					
	Animal Model:	Female BALB/c mice (4 weeks of age) with HEC-1A xenograft[3]				
	Dosage:	4 mg/kg				
	Administration:	Intravenous injection; every three days; for 3 weeks				
Solvent&Solubility	Result:	Suppressed endometrial cancer growth and angiogenesis, and induced apoptosis.				
	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 16.67 mg/mL (27.95 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)					
	Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM		1.6767 mL	8.3834 mL	16.7667 mL
5 mM			0.3353 mL	1.6767 mL	3.3533 mL	
10 mM			0.1677 mL	0.8383 mL	1.6767 mL	
*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。 储备液的保存方式和期限: -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时, 请在 6 个月内使用, -20℃ 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: 1.67 mg/mL (2.80 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 1.67 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 μL 16.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。
参考文献	[1]. Wu F, et al. Estrogen-related receptor alpha (ERRalpha) inverse agonist XCT-790 induces cell death in chemotherapeutic resistant cancer cells. Chem Biol Interact. 2009 Oct 7;181(2):236-42. [2]. Kokabu T, et al. Antitumor effect of XCT790, an ERR α inverse agonist, on ER α -negative endometrial cancer cells. Cell Oncol (Dordr). 2019 Apr;42(2):223-235. [3]. Busch BB, et al. Identification of a selective inverse agonist for the orphan nuclear receptor estrogen-related receptor alpha. J Med Chem. 2004 Nov 4;47(23):5593-6.

完整储备液配制表:

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。储备液的保存方式和期限: -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时, 请在 6 个月内使用, -20℃ 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.6767 mL	8.3834 mL	16.7667 mL	41.9168 mL
	5 mM	0.3353 mL	1.6767 mL	3.3533 mL	8.3834 mL
	10 mM	0.1677 mL	0.8383 mL	1.6767 mL	4.1917 mL
	15 mM	0.1118 mL	0.5589 mL	1.1178 mL	2.7945 mL
	20 mM	0.0838 mL	0.4192 mL	0.8383 mL	2.0958 mL
	25 mM	0.0671 mL	0.3353 mL	0.6707 mL	1.6767 mL