



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: shyyssw@sina.com

产品名称: 4-(Di(1H-indol-3-yl)methyl)phenol; DIM-C-pPhOH
CAS 号: 151358-47-3
产品货号: S87633

生物活性:	
Description	DIM-C-pPhOH 是核受体 4A1 (NR4A1) 拮抗剂。DIM-C-pPhOH 抑制癌细胞的生长和 mTOR 信号传导, 诱导细胞凋亡和细胞应激。DIM-C-pPhOH 可降低细胞增殖, 对 ACHN 细胞和 786-O 细胞的 IC50 值分别为 13.6 μ M 和 13.0 μ M。
IC50 & Target	Nur77/NR4A1
In Vitro	DIM-C-pPhOH (7.5-20 μ M; 24 小时; ACHN 和 786-O 细胞) 显著降低细胞增殖[1]。
	DIM-C-pPhOH (20 μ M; 24 小时; ACHN 和 786-O 细胞) 在 ACHN 和 786-O 细胞中诱导 Annexin V 染色, 证实 DIM-C-pPhOH 诱导细胞凋亡, 并诱导 caspases 7 和 8 的裂解[1]。
	DIM-C-pPhOH (15-20 μ M; 24 小时; ACHN 和 786-O 细胞) 抑制 ACHN 和 786-O 细胞中 NR4A1 调节的 survivin、bcl-2 和 EGFR 表达, 并且还诱导 sestrin 2, 激活 AMPK α 并抑制 mTOR 和下游激酶的激活[1]。
	DIM-C-pPhOH 可降低 MCF7、MDA-MB-231 和 SKBR3 细胞中 β 1-整合素蛋白和 mRNA 的表达以及 β 1-整合素依赖性反应, 并抑制后两种细胞系的迁移[2]。
	Cell Proliferation Assay[1]
	Cell Line: ACHN and 786-O cells
	Concentration: 7.5 μ M, 15 μ M, 20 μ M
	Incubation Time: 24 hours
	Result: Significantly decreased cell proliferation.
	Apoptosis Analysis[1]
	Cell Line: ACHN and 786-O cells
	Concentration: 20 μ M
	Incubation Time: 24 hours
	Result: Induced apoptosis in ACHN and 786-O cells.
	Western Blot Analysis[1]
	Cell Line: ACHN and 786-O cells
	Concentration: 15 μ M, 20 μ M
	Incubation Time: 24 hours
	Result: Inhibited NR4A1-regulated expression of survivin, bcl-2 and EGFR in ACHN and 786-O cells. And also induced sestrin 2, activated AMPK 伪 and inhibited activation of mTOR and downstream kinases.
In Vivo	DIM-C-pPhOH (30 mg/kg; 口服灌胃; 每日; 连续 50 天; 雄性无胸腺裸鼠) 可显著抑制肿瘤生长[1]。
	Animal Model: Male athymic nude mice (aged 6-7 weeks) injected with ACHN cells[1]
	Dosage: 30 mg/kg/day
	Administration: Oral gavage; daily; for 50 days
	Result: Resulted in a significant inhibition of tumor growth.
细胞实验:	



Solvent&Solubility	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (369.39 mM; 超声助溶 (<60°C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
	Solvent Mass Concentration Preparing Stock Solutions			
		1 mg		
		5 mg		
		10 mg		
	1 mM	2.9551 mL	14.7754 mL	29.5508 mL
	5 mM	0.5910 mL	2.9551 mL	5.9102 mL
	10 mM	0.2955 mL	1.4775 mL	2.9551 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°C, 2 years; -20°C, 1 year。 -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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: ≥ 2.08 mg/mL (6.15 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。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.15 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。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.15 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 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。				
参考文献	[1]. Hedrick E, et al. Nuclear Receptor 4A1 (NR4A1) as a Drug Target for Renal Cell Adenocarcinoma. PLoS One. 2015 Jun 2;10(6):e0128308. [2]. Hedrick E, et al. NR4A1 Antagonists Inhibit β 1-Integrin-Dependent Breast Cancer Cell Migration. Mol			



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: shyyssw@sina.com

Cell Biol. 2016 Apr 15;36(9):1383-94.

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° C, 2 years; -20° C, 1 year。 -80° C 储存时,请在 2 年内使用, -20° C 储存时,请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.9551 mL	14.7754 mL	29.5508 mL	73.8771 mL
	5 mM	0.5910 mL	2.9551 mL	5.9102 mL	14.7754 mL
	10 mM	0.2955 mL	1.4775 mL	2.9551 mL	7.3877 mL
	15 mM	0.1970 mL	0.9850 mL	1.9701 mL	4.9251 mL
	20 mM	0.1478 mL	0.7388 mL	1.4775 mL	3.6939 mL
	25 mM	0.1182 mL	0.5910 mL	1.1820 mL	2.9551 mL
	30 mM	0.0985 mL	0.4925 mL	0.9850 mL	2.4626 mL
	40 mM	0.0739 mL	0.3694 mL	0.7388 mL	1.8469 mL
	50 mM	0.0591 mL	0.2955 mL	0.5910 mL	1.4775 mL
	60 mM	0.0493 mL	0.2463 mL	0.4925 mL	1.2313 mL
	80 mM	0.0369 mL	0.1847 mL	0.3694 mL	0.9235 mL
	100 mM	0.0296 mL	0.1478 mL	0.2955 mL	0.7388 mL