



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: Irosustat
CAS 号: 288628-05-7
产品货号: S88634

生物活性:

Description	Irosustat 是一种有效的类固醇硫酸酯酶 (steroid sulfatase) 抑制剂, IC ₅₀ 值为 8 nM, 具有抗乳腺癌的活性。			
IC ₅₀ & Target	IC ₅₀ : 8 nM (Steroid sulfatase)[1], 0.2 nM (Steroid sulfatase, MCF-7 cells)[2]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	JEG-3	IC ₅₀	0.421 μM	Inhibition of steroid sulfatase in human JEG-3 cells assessed as [14C]-Estrone formation using [3H]E1S as substrate
	JEG-3	IC ₅₀	1.5 nM	Inhibition of steroid sulfatase in human JEG3 cells by scintillation spectrometry
	JEG-3	IC ₅₀	1.5 nM	Inhibition of steroid sulfatase activity in human JEG3 cells
	JEG-3	IC ₅₀	1.5 nM	Inhibition of steroid sulfatase in JEG3 cell membrane
	JEG-3	IC ₅₀	2.1 nM	Inhibition of steroid sulfatase in human JEG3 cells using [3H] E1S as substrate incubated for 20 hrs by scintillation spectrometry analysis
	JEG-3	IC ₅₀	300 nM	Inhibition of aromatase in human JEG3 cells by scintillation spectrometry
	JEG-3	IC ₅₀	300 nM	Inhibition of aromatase activity in human JEG3 cells
	JEG-3	IC ₅₀	6.4 nM	Inhibition of steroid sulfatase in human JEG3 cell lysates using [3H] E1S as substrate after 1 hr by scintillation spectrometry analysis
	MCF7	IC ₅₀	350 nM	Irreversible inhibition of steroid sulfatase in human intact MCF7 cells
	MCF7	IC ₅₀	350 nM	Inhibition of steroid sulfatase in human intact MCF7 cells
	RAW264.7	IC ₅₀	81.04 nM	Antiinflammatory activity against mouse RAW264.7 cells assessed as inhibition of LPS-induced PGE2 production administered 1 hr prior to LPS-challenge measured after 24 hrs by EIA
	RAW264.7	IC ₅₀	85.76 μM	Antiinflammatory activity against mouse RAW264.7 cells assessed as inhibition of LPS-induced NO production administered 1 hr prior to LPS-challenge measured after 24 hrs by Griess assay
	T47D	IC ₅₀	0.92 μM	Antiproliferative activity against human T47D cells assessed as reduction in cell proliferation measured after 5 days in presence of estradiol sulfate by crystal violet staining based assay
In Vitro	Irosustat (667 COUMATE) 是一种有效的类固醇硫酸酯酶抑制剂, IC ₅₀ 为 8 nM[1]。Irosustat (667 COUMATE) 抑制 MCF-7 细胞中的类固醇硫酸酯酶 (STS) 活性, IC ₅₀ 为 0.2 nM, 但在 10 μM<			



	时 对 MCF-7 细胞的形态或增殖没有影响[2].																			
In Vivo	Irosustat 可有效抑制大鼠肝脏, 浓度为 1 mg/kg 时抑制率 >90%。Irosustat (2 mg/kg, po 5 d) 阻断卵巢切除大鼠中硫酸雌酮 (E1S) 刺激的子宫生长。此外, Irosustat (2、10 mg/kg, 口服) 加 E1S 可剂量依赖性地降低去卵巢大鼠中 NMU 诱导的乳腺肿瘤的生长[1]。Irosustat (667 COUMATE; 10 mg/kg, 口服) 对大鼠肝脏中的类固醇硫酸酯酶 (STS) 活性显示出 97.9 ± 0.06% 的抑制作用[2]。																			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (323.27 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) H2O 中的溶解度 : < 0.1 mg/mL (insoluble) <table><tr><th rowspan="2">Preparing Stock Solutions</th><th>Solvent Concentration</th><th>Mass</th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th></tr><tr><th>1 mM</th><td>3.2327 mL</td><td>16.1634 mL</td><td>32.3269 mL</td></tr><tr><th rowspan="2"></th><th>5 mM</th><td>0.6465 mL</td><td>3.2327 mL</td><td>6.4654 mL</td></tr><tr><th>10 mM</th><td>0.3233 mL</td><td>1.6163 mL</td><td>3.2327 mL</td></tr></table> *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: ≥ 2.5 mg/mL (8.08 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 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (8.08 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 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (8.08 mM); 澄清溶液	Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	3.2327 mL	16.1634 mL	32.3269 mL		5 mM	0.6465 mL	3.2327 mL	6.4654 mL	10 mM	0.3233 mL	1.6163 mL	3.2327 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration		Mass	1 mg	5 mg	10 mg														
	1 mM	3.2327 mL	16.1634 mL	32.3269 mL																
	5 mM	0.6465 mL	3.2327 mL	6.4654 mL																
	10 mM	0.3233 mL	1.6163 mL	3.2327 mL																



	此方案可获得 $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (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 $100 \mu\text{L}$ 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \mu\text{L}$ 玉米油中, 混合均匀。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 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: $50\% \text{ PEG300} \rightarrow 50\% \text{ Saline}$ Solubility: 25 mg/mL (80.82 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂: $20\% \text{ SBE-}\beta\text{-CD in Saline}$ Solubility: 2 mg/mL (6.47 mM); 澄清溶液; 超声助溶。
参考文献	[1]. Purohit A, et al. In vivo inhibition of estrone sulfatase activity and growth of nitrosomethylurea-induced mammary tumors by 667 COUMATE. Cancer Res. 2000 Jul 1;60(13):3394-6. [2]. Raobaikady B, et al. Inhibition of MCF-7 breast cancer cell proliferation and in vivo steroid sulphatase activity by 2-methoxyoestradiol-bis-sulphamate. J Steroid Biochem Mol Biol. 2003 Feb;84(2-3):351-8.

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	3.2327 mL	16.1634 mL	32.3269 mL	80.8172 mL
	5 mM	0.6465 mL	3.2327 mL	6.4654 mL	16.1634 mL
	10 mM	0.3233 mL	1.6163 mL	3.2327 mL	8.0817 mL
	15 mM	0.2155 mL	1.0776 mL	2.1551 mL	5.3878 mL
	20 mM	0.1616 mL	0.8082 mL	1.6163 mL	4.0409 mL
	25 mM	0.1293 mL	0.6465 mL	1.2931 mL	3.2327 mL
	30 mM	0.1078 mL	0.5388 mL	1.0776 mL	2.6939 mL
	40 mM	0.0808 mL	0.4041 mL	0.8082 mL	2.0204 mL
	50 mM	0.0647 mL	0.3233 mL	0.6465 mL	1.6163 mL
	60 mM	0.0539 mL	0.2694 mL	0.5388 mL	1.3470 mL
	80 mM	0.0404 mL	0.2020 mL	0.4041 mL	1.0102 mL
	100 mM	0.0323 mL	0.1616 mL	0.3233 mL	0.8082 mL