



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: CITCO
CAS 号: 338404-52-7
产品货号: S89263

生物活性:				
Description	CITCO 是一种组成型雄甾烷 (Constitutive androstane) 受体激动剂, 抑制脑肿瘤干细胞 (BTSCs) 的生长和扩增。CITCO 是一种咪唑并噻唑衍生物, 其作为人 CAR 的选择性激动剂起作用。CITCO 对于孕烷 X 受体 (PXR) 的 EC50 为 49 nM, 并且对其他核受体没有活性。			
IC50 & Target	CAR, PXR[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	COS-1	EC50	0.51 μM	Agonist activity at human CAR3 expressed in African green monkey COS-1 cells cotransfected with RXRalpha after 24 hrs by CYP2B6-luciferase reporter gene assay
	HEK293	EC50	75 nM	Agonist activity at human CAR expressed in HEK293 cells by luciferase reporter gene assay
	HepG2	EC50	0.02 μM	Agonist activity at CAR LBD (108 to 348 residues) expressed in human HepG2 cells assessed as receptor binding to PGC1alpha by lanthascreenTR-FRET coactivator assay
	HepG2	EC50	0.57 μM	Agonist activity at human constitutive androstane receptor expressed in HepG2 cells co-expressing CYP2B6 incubated for 23 hrs by One-Glo luciferase reporter gene assay
	HepG2	EC50	0.62 μM	Agonist activity at human CAR transfected in human HepG2 cells cotransfected with CYP2B6 incubated for 23 hrs by luciferase reported gene assay
	HepG2	EC50	0.99 μM	Agonist activity at human PXR transfected in human HepG2 cells cotransfected with CYP3A4 incubated for 23 hrs by luciferase reporter gene assay
	In Vitro	CITCO (1-50 μM; 48 小时) 导致 T98G 和 U87MG 神经胶质瘤和 BTSCs 中活细胞计数和增殖的剂量依赖性抑制[1]。		
CITCO (2.5, 5 μM; 48 小时) 在培养的不同 BTSC 中诱导细胞周期停滞, 但在正常星形胶质细胞中没有差异[1]。				
CITCO (2.5-10 μM; 48 小时) 剂量依赖性地诱导培养物中的 BTSC 细胞凋亡, 但不诱导正常星形胶质细胞[1]。				
CITCO (0-25 μM; 48 小时) 导致 T98G 和 U87MG 胶质瘤和 BTSC 表达非常低水平的 CAR 蛋白, 而 BTSC 的 CAR 蛋白水平显著增加[1]。				
Cell Proliferation Assay[1]				
Cell Line:		T98G, U87MG, DB29 and DB33 human glioma cells, astrocytes		
Concentration:		1, 2.5, 5, 10, 25, 50 μM		
Incubation Time:		48 hours		
Result:		Resulted in a dose-dependent inhibition of viable cell count and proliferation.		
Cell Cycle Analysis[1]				
Cell Line:	The T98G, U87MG, DB29 and DB33 glioma cells			
Concentration:	2.5, 5 μM			



	Incubation Time:	48 hours			
	Result:	Induced cell cycle arrest differentially in different BTSCs in culture.			
	Apoptosis Analysis[1]				
	Cell Line:	The T98G, U87MG, DB29 and DB33 glioma cells			
	Concentration:	2.5, 5 or 10 μM			
	Incubation Time:	48 hours			
	Result:	Increased the levels of Annexin V-positive apoptotic cells in dose dependently.			
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	T98G, U87MG, DB29 and DB33 glioma cells			
	Concentration:	0 to 25 μM			
	Incubation Time:	48 hours			
	Result:	The T98G, U87MG glioma and BTSCs expressed very low levels of CAR protein that increased significantly.			
In Vivo	25 μg CITCO (腹膜内注射; 在第 22、24、26、30 和 36 天) 导致肿瘤生长显著减少, 在用 100 μg CITCO 处理后进一步降低到检测不到的水平[1]。				
	Animal Model:	Six- to eight-week-old male athymic nude mice[1]			
	Dosage:	25 or 100 μg			
	Administration:	Intraperitoneal; on days 22, 24, 26, 30 and 36			
	Result:	Decreased tumour growth.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (57.24 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 / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.2897 mL	11.4485 mL	22.8969 mL
		5 mM	0.4579 mL	2.2897 mL	4.5794 mL
		10 mM	0.2290 mL	1.1448 mL	2.2897 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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 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 → 90% Corn Oil				
Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.72 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, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌					



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: shyyysw@sina.com

	情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Chakraborty S, et al. Constitutive androstane receptor agonist CITCO inhibits growth and expansion of brain tumour stem cells. Br J Cancer. 2011 Feb 1;104(3):448-59.

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 , 6 months; -20°C , 1 month (sealed storage, away from moisture)。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 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	2.2897 mL	11.4485 mL	22.8969 mL	57.2423 mL
	5 mM	0.4579 mL	2.2897 mL	4.5794 mL	11.4485 mL
	10 mM	0.2290 mL	1.1448 mL	2.2897 mL	5.7242 mL
	15 mM	0.1526 mL	0.7632 mL	1.5265 mL	3.8162 mL
	20 mM	0.1145 mL	0.5724 mL	1.1448 mL	2.8621 mL
	25 mM	0.0916 mL	0.4579 mL	0.9159 mL	2.2897 mL
	30 mM	0.0763 mL	0.3816 mL	0.7632 mL	1.9081 mL
	40 mM	0.0572 mL	0.2862 mL	0.5724 mL	1.4311 mL
	50 mM	0.0458 mL	0.2290 mL	0.4579 mL	1.1448 mL