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：Y134
CAS 号：849662-80-2
产品货号：T87837

生物活性：

Description

Y134 is a selective and orally active oestrogen receptor (ER) modulator (SERM), exhibits potent antagonist activity at ERα and ERβ. Y134 shows 121.1-fold selectivity for ERα (Ki=0.09 nM) over ERβ (Ki=11.31 nM). Y134 inhibits oestrogen-stimulated proliferation of ER-positive human breast cancer cells[1].

IC50 & Target

ERα	ERβ
0.09 nM (Ki)	11.31 nM (Ki)

In Vitro

Y134 exhibits potent antagonist activity at ERs in CV-1 cells cotransfected with plasmids containing ERα or ERβ and oestrogen-response element-driven luciferase, with IC50s of 0.52 nM for ERα and 2.94 nM for ERβ[1].

Y134 (0.01 nM-10 μM; 6 d) inhibits the oestrogen-stimulated ER-expressing breast cancer cell (MCF-7 and T47D) proliferation[1].

Cell Viability Assay[1]

Cell Line:	MCF-7, T47, MDA-MB-231 cells
Concentration:	0.01 nM-10 μM
Incubation Time:	6 days
Result:	Suppressed oestrogen-stimulated MCF-7 and T47D cell proliferation. Showed no effects on MDA-MB-231 cells, except some cytotoxicity was seen at high concentrations.

In Vivo

Y134 (1-3 mg/kg/day; p.o. for 3 days) abolishes the E2-induced mammary gland terminal end bud (TEB) outgrowth in ovariectomized rats. Y134 inhibits uterine cell proliferation induced by E2 in a dose-dependent manner[1].

Animal Model:	Four-week old female Sprague-Dawley rats were received ovariectomy[1]
Dosage:	1, 3 mg/kg
Administration:	P.o. daily for 3 days
Result:	Abolished the effect exerted by E2 in a dose-dependent manner.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ：100 mg/mL (211.60 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	2.1160 mL	10.5798 mL	21.1595 mL
	5 mM	0.4232 mL	2.1160 mL	4.2319 mL
	10 mM	0.2116 mL	1.0580 mL	2.1160 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。-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。

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

	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 (5.29 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 ddH₂ O 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 (5.29 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 (5.29 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情使用。 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 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Ning M, et, al. Biological activities of a novel selective oestrogen receptor modulator derived from raloxifene (Y134). Br J Pharmacol. 2007 Jan;150(1):19-28.

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。-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**	2.1160 mL	10.5798 mL	21.1595 mL	52.8989 mL
	5 mM	0.4232 mL	2.1160 mL	4.2319 mL	10.5798 mL
	10 mM	0.2116 mL	1.0580 mL	2.1160 mL	5.2899 mL
	15 mM	0.1411 mL	0.7053 mL	1.4106 mL	3.5266 mL

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

	20 mM	0.1058 mL	0.5290 mL	1.0580 mL	2.6449 mL
	25 mM	0.0846 mL	0.4232 mL	0.8464 mL	2.1160 mL
	30 mM	0.0705 mL	0.3527 mL	0.7053 mL	1.7633 mL
	40 mM	0.0529 mL	0.2645 mL	0.5290 mL	1.3225 mL
	50 mM	0.0423 mL	0.2116 mL	0.4232 mL	1.0580 mL
	60 mM	0.0353 mL	0.1763 mL	0.3527 mL	0.8816 mL
	80 mM	0.0264 mL	0.1322 mL	0.2645 mL	0.6612 mL
	100 mM	0.0212 mL	0.1058 mL	0.2116 mL	0.5290 mL