

产品信息表

产品编号 ABCONE – H79043
版本 1.3

产品名称: 4-羟基他莫昔芬
英文名称: (Z)-4-Hydroxytamoxifen
产品货号: H79043
CAS 号: 68047-06-3

产品简介

4-羟基他莫昔芬是他莫昔芬(tamoxifen)的活性代谢物, 结合雌激素受体(ER)和雌激素相关受体(ERR), 具有雌激素和抗雌激素作用。4-OHT 与他莫昔芬及其其他代谢物相比, 与雌激素受体的结合具有更高的亲和力, 因此在正常人乳腺癌细胞以及培养的乳腺癌细胞系中, 其抑制细胞增殖的能力高 50 至 100 倍。

产品性状

白色至类白色粉末。

应用范围:

当胰岛素或表皮生长因子刺激细胞增殖时, 在没有雌激素的情况下, 4-OHT 可有效抑制这些细胞的生长。它是细胞渗透性的选择性雌激素受体调节剂(SERM)。在配体依赖内含肽工程 Cas9 变体中, 4-羟基他莫昔芬用于调控 Cas9 功能, 降低 CRISPR 介导的基因编辑的脱靶效应。

他莫昔芬和 4-羟基他莫昔芬被发现可诱导线粒体膜电位 ($\Delta\Psi$) 去极化并使线粒体呼吸解耦, 从而降低大鼠肝线粒体的氧化磷酸化效率。两种药物均导致线粒体 ATP 水平降低。此外, 发现 4-OHT 可以保护脑线粒体免受氧化应激。

使用方法:

注意: 不同实验方法可能不同, 应根据实际使用效果、实验经验和设置加以调整和更改。此处提供的是常规使用方法, 仅供参考。

细胞实验:

4-羟基他莫昔芬可对 CreERT2-LoxP 动物模型 (如小鼠) 的体外细胞, 进行诱导基因敲除, 方法如下。

1. 4-羟基他莫昔芬溶解于乙醇里, 制备 5mg/ml 的母液。
2. 母液可以在 -20° C 避光保存大概 2 个月。
3. 使用时, 用培养基稀释至 0.02mg/ml。
4. 处理细胞 24 小时, 就应该得到理想的诱导基因敲除效果。

5. 24 小时后，替换至常规培养基中。

当暴露在光下和在培养基中孵育时，4-OHT 发生顺式-反式 (E-Z) 互变过程，尤其在低介电常数溶剂中。这种异构化会在所有常见的实验室溶剂中发生，但可以通过将化合物存储在含有 ~0.025% 丁羟甲苯 (BHT) 的四氢呋喃中在 -25 °C 的避光条件下保存来防止。此溶液可保持活性约 6 个月，异构体纯度损失小于 5%。

动物实验：

1. 4-羟基他莫昔芬 (4-OHT) 溶解在乙醇中，在 37° C 下振荡 15 分钟或超声助溶，制备 20 mg/mL 的母液。
2. 母液等分并在 -20° C 避光保存约 2 个月。
3. 使用前，通过在 37° C 下震荡 15 分钟将 4-OHT 重新溶解在乙醇中，加入无水乙醇 2 倍体积的玉米油混匀，摇晃 15 分钟，静置使液体分层，打开离心管盖子使酒精自然挥发，得到最终浓度为 10 mg/mL 4-OHT。如有需要，可以在加入油溶剂后分装成小管并在离心下真空蒸发乙醇，注意每个离心管内装入溶液体积不要超过 1/2，以免造成离心过程中开口离心管产生喷溅损耗。
4. 使用前，最终的 10 mg/mL 4-OHT 溶液在 4°C 下最多保存 24 小时。所有注射均通过腹膜内 (i.p.) 进行，注射剂量为 50mg/kg。

储存条件

存放在 2 - 8° C 的干燥避光处，产品保持活性 3 年。

注意事项

本产品仅用于实验室研究，不能药用或其它用途