



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: **H3B-6527**
CAS 号: **1702259-66-2**
产品货号: **S88470**

生物活性:				
Description	H3B-6527 是一种具有口服活性的, 高选择性和共价 FGFR4 抑制剂, IC50 <1.2 nM。H3B-6527 抑制 FGFR1-3, IC50 分别为 320、1290 和 1060 nM。H3B-6527 具有良好的抗癌活性。			
IC50 & Target[1]	FGFR4 <1.2 nM (IC50)	FGFR1 320 nM (IC50)	FGFR2 1290 nM (IC50)	FGFR3 1060 nM (IC50)
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	BaF3	IC50	0.9 nM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells harboring wild type FGFR4 assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by CCK-8 assay
	BaF3	IC50	35.5 nM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells harboring FGFR4 V550L mutant assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by CCK-8 assay
	BaF3	IC50	60.3 nM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells harboring FGFR4 V550M mutant assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by CCK-8 assay
In Vitro	H3B-6527 inhibits TAOK2, JNK2, and CSF1R with IC50s of 690 nM, >10000 nM, and >10000 nM, respectively[1].			
	H3B-6527 (10-10000 nM; 72 hours) results in a GI50 value of 25 nM[1].			
	H3B-6527 (10-10000 nM; 72 hours) leads cell death in HCC cell lines[1].			
	H3B-6527 (0.1-1000 nM; 1 hour) decreases the levels of pERK1/2 in a dose-dependent manner with maximal inhibition occurring at 100 nM[1].			
	H3B-6527 (1-1000 nM; 24 hours) causes a robust increase in CYP7A1 transcripts[1].			
	Cell Proliferation Assay[1]			
	Cell Line:	Hepatocellular carcinoma (HCC) cell line Hep3B		
	Concentration:	10, 100, 1000, 10000 nM		
	Incubation Time:	72 hours		
	Result:	Resulted in a GI50 value of 25 nM.		
	Apoptosis Analysis[1]			
	Cell Line:	Hepatocellular carcinoma (HCC) cell line Hep3B		
	Concentration:	10, 100, 1000, 10000 nM		
	Incubation Time:	72 hours		
	Result:	Led cell death in HCC cell lines.		
	Western Blot Analysis[1]			
	Cell Line:	Hepatocellular carcinoma (HCC) cell line Hep3B		
	Concentration:	0.1, 0.3, 1, 3, 10, 100, 1000 nM		
	Incubation Time:	1 hour		
Result:	Decreased the levels of pERK1/2 in a dose-dependent manner with maximal inhibition occurring at 100 nM.			
RT-PCR[1]				
Cell Line:	Hepatocellular carcinoma (HCC) cell line Hep3B			



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

	<table><tr><td>Concentration:</td><td>1, 10, 100, 1000 nM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Caused a robust increase in CYP7A1 transcripts.</td></tr></table>	Concentration:	1, 10, 100, 1000 nM	Incubation Time:	24 hours	Result:	Caused a robust increase in CYP7A1 transcripts.																										
Concentration:	1, 10, 100, 1000 nM																																
Incubation Time:	24 hours																																
Result:	Caused a robust increase in CYP7A1 transcripts.																																
In Vivo	<table><tr><td colspan="2">H3B-6527 (10-300 mg/kg; orally; twice-daily; for 15 days) significantly inhibits tumor growth at the 300 and 100 mg/kg and does not inhibit tumor growth at 30 and 10 mg/kg[1]。</td></tr><tr><td>Animal Model:</td><td>BALB/c nu/nu female mice approximately 8-week-old, weighing 18-20 g bearing Hep3B orthotopic xenografts in liver[1]</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>10, 30, 100, 300 mg/kg</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>Orally; twice-daily; for 15 days</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Inhibited tumor growth at the 300 and 100 mg/kg twice-daily dose.</td></tr></table>	H3B-6527 (10-300 mg/kg; orally; twice-daily; for 15 days) significantly inhibits tumor growth at the 300 and 100 mg/kg and does not inhibit tumor growth at 30 and 10 mg/kg[1]。		Animal Model:	BALB/c nu/nu female mice approximately 8-week-old, weighing 18-20 g bearing Hep3B orthotopic xenografts in liver[1]	Dosage:	10, 30, 100, 300 mg/kg	Administration:	Orally; twice-daily; for 15 days	Result:	Inhibited tumor growth at the 300 and 100 mg/kg twice-daily dose.																						
H3B-6527 (10-300 mg/kg; orally; twice-daily; for 15 days) significantly inhibits tumor growth at the 300 and 100 mg/kg and does not inhibit tumor growth at 30 and 10 mg/kg[1]。																																	
Animal Model:	BALB/c nu/nu female mice approximately 8-week-old, weighing 18-20 g bearing Hep3B orthotopic xenografts in liver[1]																																
Dosage:	10, 30, 100, 300 mg/kg																																
Administration:	Orally; twice-daily; for 15 days																																
Result:	Inhibited tumor growth at the 300 and 100 mg/kg twice-daily dose.																																
Solvent&Solubility	<table><tr><td colspan="5">细胞实验:</td></tr><tr><td colspan="5">DMSO 中的溶解度 : 2.5 mg/mL (3.97 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)</td></tr><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> Solvent / Mass / Concentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>1.5885 mL</td><td>7.9423 mL</td><td>15.8846 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>---</td><td>---</td><td>---</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>---</td><td>---</td><td>---</td></tr><tr><td colspan="5"> *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。 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: ≥ 0.25 mg/mL (0.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 2.5 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: ≥ 0.25 mg/mL (0.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 2.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD </td></tr></table>	细胞实验:					DMSO 中的溶解度 : 2.5 mg/mL (3.97 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	1.5885 mL	7.9423 mL	15.8846 mL	5 mM	---	---	---	10 mM	---	---	---	*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。 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: ≥ 0.25 mg/mL (0.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 2.5 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: ≥ 0.25 mg/mL (0.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 2.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD				
细胞实验:																																	
DMSO 中的溶解度 : 2.5 mg/mL (3.97 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	1.5885 mL	7.9423 mL	15.8846 mL																													
	5 mM	---	---	---																													
	10 mM	---	---	---																													
*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。 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: ≥ 0.25 mg/mL (0.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 2.5 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: ≥ 0.25 mg/mL (0.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 2.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD																																	



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

	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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 0.25 mg/mL (0.40 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.25 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 2.5 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]. Joshi JJ, et al. H3B-6527 Is a Potent and Selective Inhibitor of FGFR4 in FGF19-Driven HepatocellularCarcinoma. Cancer Res. 2017 Dec 15;77(24):6999-7013.

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	1.5885 mL	7.9423 mL	15.8846 mL	39.7115 mL