



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: JNJ-63576253

CAS 号: 2110428-64-1

产品货号: S89278

生物活性:

生物活性:

Description	JNJ-63576253 (TRC-253) 是一种有效和具有口服活性的雄激素受体 (androgen receptor) 的完全拮抗剂, 在 LNCaP 细胞中对 F877L 突变型 AR 和野生型 AR 的 IC50 值分别为 37 和 54 nM。JNJ-63576253 可用于去势抵抗性前列腺癌 (CRPC) 的研究。				
IC50 & Target	IC50: 37 nM (F877L mutant AR in LNCaP cells); 54 nM (wild-type AR in LNCaP cells)[1].				
In Vitro	JNJ-63576253 (0.0003-100 μM; 5 d) 抑制 VCaP 细胞的生长, IC50 为 265 nM[1]。 JNJ- 63576253 在人肝微粒体中稳定, T1/2 >180 分钟[1]。				
In Vivo	JNJ-63576253 (30 mg/kg; 每天口服一次, 持续 72 天) 显著抑制小鼠前列腺 LNCaP SR α F877L 肿瘤的生长[1]。 JNJ-63576253 (30 mg/kg; po 每天一次, 持续 10 天) 抑制小鼠丙酸睾酮 (TP) 刺激下的五个雄激素敏感器官 (ASO)[1]。 JNJ-63576253 (10 mg/kg; po) 表现出适度的口服生物利用度 (45%)、Cmax (0.66 μM) 和 AUClast (4.9 μg h/mL) 在小鼠体内[1]。 JNJ-63576253 (2 mg/kg; 静脉注射) 表现出合理的半衰期 (5.99 小时)、CL (15.0 mL/min/kg) 和 Vdss (6.11 L/kg) 在小鼠中[1]。				
	Animal Model:	Castrated SHO mice with prostate LNCaP SRα F877L tumor[1]			
	Dosage:	30 mg/kg			
	Administration:	P.o. once daily for 72 days			
	Result:	Inhibited the tumor growth by 87%.			
	Animal Model:	CD-1 male mice[1]			
	Dosage:	2 mg/kg for i.v.; 10 mg/kg for p.o. (Pharmacokinetic Analysis)			
	Administration:	Intravenous administration and oral administration			
	Result:	I.v.: T1/2=5.99 h; CL=15.0 mL/min/kg; Vdss=6.11 L/kg. P.o.: F=45%; Cmax=0.66 μM; AUClast=4.9 μg•h/mL.			
	Solvent&Solubility	细胞实验:			
DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (463.85 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	1.8554 mL	9.2770 mL	18.5539 mL
		5 mM	0.3711 mL	1.8554 mL	3.7108 mL
10 mM	0.1855 mL	0.9277 mL	1.8554 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.86 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (3.86 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (3.86 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Zhang Z, et, al. Discovery of JNJ-63576253: A Clinical Stage Androgen Receptor Antagonist for F877L Mutant and Wild-Type Castration-Resistant Prostate Cancer (mCRPC). J Med Chem. 2021 Jan 28;64(2):909-924.

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	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				
DMSO	1 mM	1.8554 mL	9.2770 mL	18.5539 mL	46.3848 mL
	5 mM	0.3711 mL	1.8554 mL	3.7108 mL	9.2770 mL
	10 mM	0.1855 mL	0.9277 mL	1.8554 mL	4.6385 mL
	15 mM	0.1237 mL	0.6185 mL	1.2369 mL	3.0923 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: shyyssw@sina.com

	20 mM	0.0928 mL	0.4638 mL	0.9277 mL	2.3192 mL
	25 mM	0.0742 mL	0.3711 mL	0.7422 mL	1.8554 mL
	30 mM	0.0618 mL	0.3092 mL	0.6185 mL	1.5462 mL
	40 mM	0.0464 mL	0.2319 mL	0.4638 mL	1.1596 mL
	50 mM	0.0371 mL	0.1855 mL	0.3711 mL	0.9277 mL
	60 mM	0.0309 mL	0.1546 mL	0.3092 mL	0.7731 mL
	80 mM	0.0232 mL	0.1160 mL	0.2319 mL	0.5798 mL
	100 mM	0.0186 mL	0.0928 mL	0.1855 mL	0.4638 mL



源叶