



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: shyyw@sina.com

产品名称: **UT-34**
CAS 号: **2168525-92-4**
产品货号: **S89769**

生物活性:

生物活性:		
Description	UT-34 is a potent, selective, orally bioactive second-generation pan-androgen receptor (AR) antagonist and degrader, with IC50 values of 211.7 nM, 262.4 nM, and 215.7 nM for wild-type AR, F876L-AR, and W741L-AR, respectively. UT-34 binds to the ligand-binding domain (LBD) and functional 1 (AF-1) domain of AR and requires the ubiquitin-proteasome pathway for AR degradation. UT-34 has anti-prostate cancer effects.	
IC50 & Target	IC50: 211.7 nM (Wild-type AR), 262.4 nM (F876L AR) and 215.7 nM (W741L AR)[1]	
In Vitro	UT-34 (3-10 μM; 24 小时; LNCaP 细胞) 处理从 100 nM 开始抑制 PSA 和 FKBP5 的表达以及 LNCaP 细胞的生长, 在 10 μM 时观察到最大效果[1]。 UT-34 (0.1-10 μM; 24 小时; LNCaP 细胞) 处理导致 LNCaP 细胞中 1000 nM 的 AR 水平降低[1]。ZR-75-1 细胞维持在含有 UT-34 的血清生长培养基中会导致 AR 蛋白水平下调, 但不会下调雌激素受体 (ER) 或孕激素受体 (PR) 水平。此外, 在表达 AR 和糖皮质激素受体 (GR) 的 MDA-MB-453 乳腺癌细胞中, UT-34 诱导 AR 的下调, 但不诱导 GR[1]。 UT-34 是 AR 和 AR-V7 的有效降解剂。LNCaP-ARV7 细胞在 0.1 nM R1881 或 10 ng/mL 强力霉素存在下处理 24 小时。多西环素诱导 EDN2 的表达, 被 UT-34 抑制, 而 UT-34 抑制 R1881 诱导的 FKBP5 基因表达[1]。	
	C	
	Cell Viability Assay[1]	
	Cell Line:	LNCaP cells
	Concentration:	3 μM, 10 μM
	Incubation Time:	24 hours
	Result:	Inhibited the expression of PSA and FKBP5 and growth of LNCaP cells starting from 100 nM with maximum effect observed at 10 μM.
	Western Blot Analysis[1]	
	Cell Line:	LNCaP cells
	Concentration:	0.1 μM, 1 μM, 10 μM
Incubation Time:	24 hours	
Result:	Resulted in a reduction of AR levels at 1000 nM.	
In Vivo	UT-34 (3-10 μM; 24 小时; LNCaP 细胞) 处理从 100 nM 开始抑制 PSA 和 FKBP5 的表达以及 LNCaP 细胞的生长, 在 10 μM 时观察到最大效果[1]。 UT-34 (0.1-10 μM; 24 小时; LNCaP 细胞) 处理导致 LNCaP 细胞中 1000 nM 的 AR 水平降低[1]。ZR-75-1 细胞维持在含有 UT-34 的血清生长培养基中会导致 AR 蛋白水平下调, 但不会下调雌激素受体 (ER) 或孕激素受体 (PR) 水平。此外, 在表达 AR 和糖皮质激素受体 (GR) 的 MDA-MB-453 乳腺癌细胞中, UT-34 诱导 AR 的下调, 但不诱导 GR[1]。 UT-34 是 AR 和 AR-V7 的有效降解剂。LNCaP-ARV7 细胞在 0.1 nM R1881 或 10 ng/mL 强力霉素存在下处理 24 小时。多西环素诱导 EDN2 的表达, 被 UT-34 抑制, 而 UT-34 抑制 R1881 诱导的 FKBP5 基因表达[1]。	
	Animal Model:	Non obese diabetic/severe combined immunodeficiency Gamma (NSG) mice injected with MR49F cells[1]



	Dosage:	20 mg/kg or 40 mg/kg			
	Administration:	Oral administration; daily; for 14 days			
	Result:	Reduced the seminal vesicle weight.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (701.71 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	2.8069 mL	14.0343 mL	28.0686 mL
		5 mM	0.5614 mL	2.8069 mL	5.6137 mL
		10 mM	0.2807 mL	1.4034 mL	2.8069 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。 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 (5.84 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 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.84 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 (5.84 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。					



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

	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 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]. Ponnusamy S, et al. Orally Bioavailable Androgen Receptor Degradar, Potential Next-Generation Therapeutic for Enzalutamide-Resistant Prostate Cancer. Clin Cancer Res. 2019 Nov 15;25(22):6764-6780. [2]. Stone L. UT-34: a promising new AR degrader. Nat Rev Urol. 2019 Nov;16(11):640.

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	2.8069 mL	14.0343 mL	28.0686 mL	70.1715 mL
	5 mM	0.5614 mL	2.8069 mL	5.6137 mL	14.0343 mL
	10 mM	0.2807 mL	1.4034 mL	2.8069 mL	7.0172 mL
	15 mM	0.1871 mL	0.9356 mL	1.8712 mL	4.6781 mL
	20 mM	0.1403 mL	0.7017 mL	1.4034 mL	3.5086 mL
	25 mM	0.1123 mL	0.5614 mL	1.1227 mL	2.8069 mL
	30 mM	0.0936 mL	0.4678 mL	0.9356 mL	2.3391 mL
	40 mM	0.0702 mL	0.3509 mL	0.7017 mL	1.7543 mL
	50 mM	0.0561 mL	0.2807 mL	0.5614 mL	1.4034 mL
	60 mM	0.0468 mL	0.2339 mL	0.4678 mL	1.1695 mL
	80 mM	0.0351 mL	0.1754 mL	0.3509 mL	0.8771 mL
	100 mM	0.0281 mL	0.1403 mL	0.2807 mL	0.7017 mL