

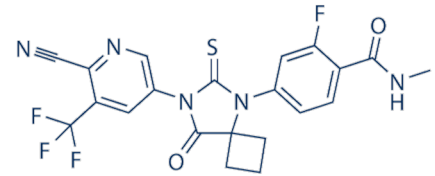
ARN-509 (Androgen Receptor抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD0033-10mM	ARN-509 (Androgen Receptor抑制剂)	10mM×0.2ml
SD0033-5mg	ARN-509 (Androgen Receptor抑制剂)	5mg
SD0033-25mg	ARN-509 (Androgen Receptor抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[7-[6-cyano-5-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]-8-oxo-6-sulfanylidene-5,7-diazaspiro[3.4]octan-5-yl]-2-fluoro-N-methylbenzamide
简称	ARN-509
别名	ARN 509, ARN509
中文名	N/A
化学式	C ₂₁ H ₁₅ F ₄ N ₅ O ₂ S
分子量	477.43
CAS号	956104-40-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 18mg/ml; Ethanol 5mg/ml
溶液配制	5mg加入1.05ml DMSO, 或每4.77mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD0033-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	ARN-509是一种选择性的, 竞争性androgen receptor抑制剂, 无细胞试验中IC ₅₀ 为16nM, 对前列腺癌的治疗有效。Phase 3。				
信号通路	Endocrinology & Hormones				
靶点	Androgen Receptor	GABAA receptor	—	—	—
IC ₅₀	16nM	3μM	—	—	—
体外研究	在LNCaP/AR前列腺癌细胞系中ARN-509(<10μM)抑制雄激素介导的13种内源基因mRNA表达水平的诱导或抑制, 包括PSA和TMPRSS2。ARN-509(<10μM) 抑制LNCaP/AR前列腺癌细胞系中R1881(30pM)的增殖效果。在表达AR-EYFP的LNCaP细胞中ARN-509(10μM)会破坏AR的核定位因此会使与雄激素响应元件结合的AR浓度下降。10μM ARN-509可以有效的与1nM R1881竞争从而阻止AR结合启动子区域。在表达VP16-AR融合蛋白的Hep-G2细胞以及ARE驱使的荧光素酶报告基因系统中ARN-509会抑制R1881诱导的VP16-AR介导的转录水平, IC ₅₀ 为0.2μM。				
体内研究	在携带LNCaP/AR-luc异种移植肿瘤的雄性阉割后的免疫缺陷小鼠模型中ARN-509(10mg/kg/天, 口服)会抑制肿瘤生长, 表现为增殖率下降和凋亡率上升。对于携带LNCaP/AR-luc异种移植肿瘤的雄性阉割后的免疫缺陷小鼠ARN-509在30mg/kg/天剂量时对肿瘤生长抑制的效果最好, 抑制作用具有剂量依赖性。用10mg/kg/天剂量的ARN-509处理28天, 可以使缺少腺体分泌活性的前列腺重量减轻3倍, 使成年雄狗的睾丸重量下降1.7倍。ARN-509(10mg/kg/天, 口服)会抑制成年雄狗前列腺组织的细胞增殖。在24例已经接受了前期治疗的带有转移性CRPC病人中ARN-509是安全的, 耐受性良好, 血药峰值出现在用药后2到3小时。在带有转移性CRPC病人中ARN-509在30到300mg剂量范围内会导致PSA的持续下降。在阉割抗前列腺癌小鼠模型中ARN-509具有很强的抗癌活性并能诱导治疗完成后长时间的症状缓解。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	LNCaP/AR前列腺癌细胞系
浓度	10 μ M
处理时间	48小时
方法	细胞培养48小时，然后在RPMI培养基中加入16 μ l ARN-509。对于拮抗剂模型分析，用含有30pM R1881的培养基稀释ARN-509。孵育7天之后，加入16 μ l CellTiter-Glo Luminescent Cell Viability Assay然后测量相关的发光单位(RLU)。

动物实验	
动物模型	携带LNCaP/AR-luc异种移植肿瘤的雄性阉割后的免疫缺陷小鼠
配制	20mM柠檬酸盐缓冲液(pH 4.0)，含有15% Vitamin E-TPGS和65%的0.5% w/v CMC溶液
剂量	30mg/kg/天
给药方式	口服

➤ **参考文献:**

1.Clegg NJ, et al. Cancer Res, 2012, 72(6), 1494-1503.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD0033-10mM	ARN-509 (Androgen Receptor抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SD0033-5mg	ARN-509 (Androgen Receptor抑制剂)	5mg
SD0033-25mg	ARN-509 (Androgen Receptor抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制成高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01