

LOXO-101; Larotrectinib

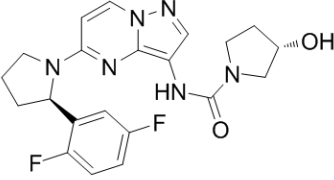
产品编号：MB3277

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG; 50MG

产品形式：白色至黄色固体

基本信息

分子式	C ₂₁ H ₂₂ F ₂ N ₆ O ₂	结 构 式	
分子量	428.44		
CAS No.	1223403-58-4		
储存条件	2-8℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: ≥ 4.6 mg/mL Water : insoluble Ethanol : insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介： LOXO-101 是一种原肌球蛋白受体激酶(TRK)的选择性抑制剂。

别名： LOXO 101; LOXO-101; LOXO101; ARRY-470; ARRY470; ARRY 470; larotrectinib ;

N-[5-[(2R)-2-(2,5-difluorophenyl)-1-pyrrolidinyl]pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-3-yl]-3-hydroxy-, (3S)-

物理性状及指标：

外观：.....白色至黄色固体

溶解性：.....DMSO: ≥ 4.6 mg/mL ; Water : insoluble ; Ethanol : insoluble

含量：.....>98%

储存条件： 2-8℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

LOXO-101 是一种有效的 ATP 竞争性 Trk 抑制剂，其在低纳摩尔范围内具有 IC₅₀s，用于抑制所有 Trk 家族成员在结合和细胞分析中，对其他激酶具有 100X 选择性，对 TrkA、TrkB 和 TrkC 激酶具有 2 至 20 nm 的细胞效价。在体内：单剂量 (30 mg/kg) 的 LOXO-101 减少 TrkA 酪氨酸磷酸化和肿瘤中的下游信号转导 (PERK) > 80%。在该模型中，LOXO-101 耐受性高达 200 mg/kg/天，持续 14 d。在体外：LOXO-101 被评价为靶向激酶抑制剂对 226 个非 Trk 激酶的抑制作用，在 1000 nm 的化合物浓度和每种酶的 KM 附近的 ATP 浓度。LOXO-101 仅对一种非 Trk 激酶 (TNK2 IC₅₀ = 576 nm) 表现出 50% 以上的抑制作用。

用途及描述： 科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。Larotrectinib，又名 ARRY-470 和 LOXO-101，是一种口服可生物利用的、有效的 ATP 竞争性抑制剂 TrkA、TrkB 和 TrkC。LOXO-101 具有在低纳摩尔范围内的 IC₅₀ 值，用于抑制所有三个 Trk 家族成员在结合和细胞分析中，与其他激酶相比具有 100X 选择性，并且在非临床模型中显示了可接受的药物性质和安全性。神经营养因子受体 TRK 家族、TrkA、TrkB 和 TrkC (分别由 NTrk1、NTrk2 和 NTrk3 基因编码) 及其神经营养配体调节神经元的生长、分化和存活。

储液配置：

体 DMSO 质 量 浓度 积 量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3340 mL	11.6702 mL	23.3405 mL
5 mM	0.4668 mL	2.3340 mL	4.6681 mL
10 mM	0.2334 mL	1.1670 mL	2.3340 mL

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。