

**PF06463922 ; PF-06463922**

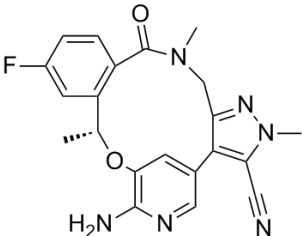
产品编号：MB3330

质量标准：≥98%

包装规格：5MG;25MG

产品形式：powder

**基本信息**

分子式	C21H19FN6O2	结 构 式	
分子量	406.41		
CAS No.	1454846-35-5		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO ≥28 mg/mL warmed		
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：**劳拉替尼 PF-06463922 是一种有效的，ALK/ROS1 双抑制剂，抑制 ROS1，野生 ALK 和 突变 ALK (L1196M) 的  $K_i$  分别为 0.02 nM，0.07 nM 和 0.7 nM。

**别名：**Lorlatinib ; PF06463922 ; 劳拉替

尼 (10R)-7-Amino-12-fluoro-2,10,16-trimethyl-15-oxo-10,15,16,17-tetrahydro-2H,8,4-(metheno)pyrazolo[4,3,h][2,5,11]-benzoxadiazacyclotetradecine-3-carbonitrile

**物理性状及指标：**

外观：.....白色粉末

溶解性：.....DMSO ≥28 mg/mL warmed

含量：.....≥98%

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

**生物活性**

<b>产品描述</b>	PF-06463922 是一个强效的，双重 ALK/ ROS1 的抑制剂，对 ROS1, ALK (WT), 以及 ALK (L1196M)的 $K_i$ 分别为<0.02 nM, <0.07 nM, 和 0.7 nM。				
<b>靶点</b>	ROS1 (Cell-free assay)	ALK (Cell-free assay)	ALK (L1196M) (Cell-free assay)	LTK (TYK1) (Cell-free assay)	FER (Cell-free assay)
	<0.02 nM(Ki)	<0.07 nM(Ki)	0.07 nM(Ki)	2.7 nM	3.3 nM
<b>体外研究</b>	PF-06463922 对 ALK 和大量 ALK 临床突变型表现出显著的细胞活性，IC50 范围为 0.2 nM-77 nM。在含有 SLC34A2-ROS1 融合物的 HCC78 人 NSCLC 细胞和表达人 CD74-ROS1 的 BaF3-CD74-ROS1 细胞中，PF-06463922 显著抑制细胞增殖，并诱导细胞凋亡。在含有非突变				

	型 ALK 或突变型 ALK 融合物的 NSCLC 细胞中，PF-06463922 也表现出有效的生长抑制活性，并诱导细胞凋亡。
<b>体内研究</b>	在大鼠体内，PF-06463922 显示出低血浆清除率，适度的分布容积，合理的半衰期，对低 P-糖蛋白 1 介导的外排敏感性低，且生物利用度为 100%。在体内，表达人 CD74-ROS1 和 Fig-ROS1 的 NIH3T3 异种移植模型中，PF-06463922 表现出细胞减少性抗癌作用，通过抑制 ROS1 磷酸化和下游信号分子，以及对肿瘤中细胞周期蛋白 D1 的抑制发挥作用。在负荷肿瘤移植动物，过表达 EML4-ALK，EML4-ALK-L1196M，EML4-ALK-G1269A，EML4-ALK-G1202R 或 NPM-ALK 的小鼠体内，PF-06463922 也表现出显著的抗肿瘤活性。

**美仑相关产品推荐**

MB4539	RXDX-101
MB4537	AZD3463
MB5584	Alectinib ; CH5424802
MB4538	ASP3026
MB3330	PF-06463922

**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。Lorlatinib (PF-06463922) 是一种有效的、选择性的、可穿透性的抗间变性淋巴瘤激酶(ALK)和 c-ros 致癌基因 1 (ROS1)的抑制剂，对在 crizotinib 耐药患者中发现的大多数已知的 ALK 和 ROS1 突变体具有很强的活性。本品适用于该领域科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4606 mL	12.3028 mL	24.6057 mL
5 mM	0.4921 mL	2.4606 mL	4.9211 mL
10 mM	0.2461 mL	1.2303 mL	2.4606 mL
50 mM	0.0492 mL	0.2461 mL	0.4921 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用粉末配置工作液。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。