

Torin1

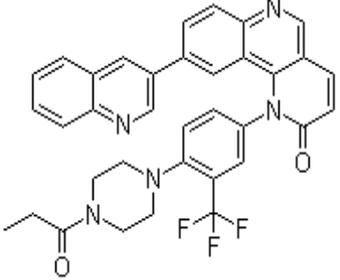
产品编号：MB3467

质量标准：>98%，效的 mTORC1/2 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;100MG

产品形式：powder

基本信息

| | | | |
|---------------|-------------------------------|-----|---|
| 分子式 | C35H28F3N5O2 | 结构式 |  |
| 分子量 | 607.64 | | |
| CAS No. | 1222998-36-8 | | |
| 储存条件 | -20°C，避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO：2 mg/mL (3.29 mM) | | |
| | 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：Torin 1 是一种有效的 mTOR 抑制剂，IC₅₀ 为 3 nM。Torin 1 抑制 mTORC1/2 复合物，IC₅₀ 值在 2 和 10 nM 之间。

别名：mTOR Inhibitor XI, Torin1;

1-(4-(4-propionylpiperazin-1-yl)-3-(trifluoromethyl)phenyl)-9-(quinolin-3-yl)benzo[h][1,6]naphthyridin-2(1H)-one, DNA-PK Inhibitor VI, PI 3-K Inhibitor XVIII

物理性状及指标：

外观：.....黄白色粉末

溶解性：.....DMSO：2 mg/mL (3.29 mM);Water Insoluble;Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

| | | | | | |
|-------------|---|------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|-------------------------------|
| 产品描述 | Torin 1 是一种有效的 mTORC1/2 抑制剂，在无细胞试验中 IC ₅₀ 为 2 nM/10 nM；作用于 mTOR 比作用于 PI3K 选择性高 1000 倍。 | | | | |
| 靶点 | mTORC1 (Cell-free assay) | mTOR (Cell-free assay) | DNA-PK (Cell-free assay) | mTORC2 (Cell-free assay) | p110γ (Cell-free assay) |
| | 2 nM | 4.32 nM | 6.34 nM | 10 nM | 171 nM |
| 体外研究 | Torin1 在 2 和 10 nM 浓度下分别抑制 mTORC1 和 mTORC2 底物的磷酸化。此外，Torin1 对 mTOR 比对 PI3K (EC ₅₀ = 1800 nM)的选择性高 1000 倍，比对 450 种其它蛋白激酶的结合选择性高 100 倍。Torin1 通过耐 rapamycin 机制引起细胞周期阻滞，并且其不依赖于 | | | | |

| | |
|-------------|--|
| | mTORC2。Torin1 比 rapamycin 更完全地干扰 mTORC1 依赖表现型。Cap 依赖性翻译需要 mTORC1 耐 Rapamycin 的功能。在近期的一项研究中,据报道 Torin1 通过活化人内分泌细胞系 BON 中 MEK/ERK/c-Jun 通路,能够增加神经降压素分泌和基因表达。 |
| 体内研究 | Torin1 在 20 mg/kg 剂量下,在 U87MG 异种移植模型中是有效的,并且在肿瘤和外周组织中对 mTOR 下游效应蛋白表现出良好的药效学抑制作用。 |

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

| | |
|--------|---------------------|
| MB3869 | GSK2126458 (GSK458) |
| MB3892 | Palomid 529 (P529) |

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。一种细胞可渗透的吡啶酮衍生物,对 mTOR 和 DNA-PK (IC50 分别为 4.32 和 6.34 nM) 具有很强的 atp 竞争性抑制作用,可用于相关领域的科研实验。

储液配置

| 体质量 浓度积 | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
|------------|-----------|-----------|------------|
| 1 mM | 1.6458 mL | 8.2288 mL | 16.4577 mL |
| 5 mM | - | - | - |
| 10 mM | - | - | - |
| 50 mM | - | - | - |

经典实验操作 (仅供参考)

| | |
|--------------|--|
| 激酶实验: | <p>mTORC1 和 mTORC2 体外激酶试验:</p> <p>为产生可溶性 mTORC1, HEK-293T 细胞系, 稳定表达 N 端 FLAG 标记的 Raptor, 使用水泡性口炎病毒 G-假型病毒 MSCV 逆转录酶病毒产生。对于 mTORC2, 产生相似的 HeLa 细胞, 能够稳定表达 N 端 FLAG-标记的 Protor-1。两个复合物通过在 50 mm HEPES, pH 7.4, 10 mm 焦磷酸钠, 10 mm β-甘油磷酸钠, 100 mm NaCl, 2 mm EDTA, 0.3% CHAPS 中裂解细胞纯化。细胞在 4 °C 下裂解 30 分钟, 不溶解部分通过以 13,000 rpm 微量离心 10 分钟移除。上清液与 FLAG-M2 单克隆抗体-琼脂糖培育 1 小时, 然后用裂解缓冲液洗涤 3 次, 用包含终浓度 0.5 M NaCl 的裂解缓冲液洗涤 1 次。纯化的 mTORC1 用 100 μg/mL 3×FLAG 多肽在 50 mm HEPES, pH 7.4, 100 mm NaCl 中洗脱。将洗出液等分收集, 储存在 -80 °C。纯化底物 S6K1 和 Akt1。激酶试验在 30 °C, 由激酶缓冲液(25 mm HEPES, pH 7.4, 50 mm KCl, 10 mm MgCl2, 500 μm ATP)和 150 ng 灭活的 S6K1 或 Akt1 底物组成的 20 μL 终体积混合物中进行。反应通过加入 80 μL 样品缓冲液停止, 并煮沸 5 分钟。随后, 样品通过 SDS-PAGE 和免疫印迹法分析。</p> |
| 细胞实验: | <p>Cell lines: MEFs</p> <p>Concentrations: ~250 nM</p> <p>Incubation Time: 4 天</p> <p>Method: 细胞活性通过 CellTiter-Glo 发光法细胞活性测定评估。在第 0 天, 细胞以 500 细胞每孔接种到 96 孔板, 并生长过夜。第 1 天, 细胞用适当的化合物处理, 随后在第 3-5 天分析。对于分析, 板在室温下培育 60 分钟, 将 50 μL CellTiter-Glo 试剂加入每孔中, 板在定轨摇床上混合 12 分钟。发光在标准平板光度计上定量。</p> |

| | |
|--------------|--|
| 动物实验： | Animal Models: U87MG 异种移植瘤模型 Formulation: Torin1 粉末首先以 25 mg/mL 在 100% N-甲基-2-吡咯烷酮中溶解，随后以 1:4 与无菌 50% PEG400 稀释到 5 mg/mL 的终浓度 Dosages: 20 mg/kg Administration: 腹腔注射给药，每天一次 |
|--------------|--|

【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。