

Torin 2

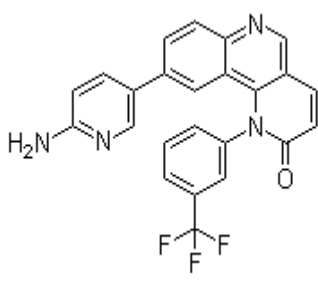
产品编号：MB3476

质量标准：>98%，选择性 mTOR 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;100MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C ₂₄ H ₁₅ F ₃ N ₄ O	结构式	
分子量	432.4		
CAS No.	1223001-51-1		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 20 mg/mL (46.25 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 2 是一种 mTOR 抑制剂，抑制细胞内 mTOR 活性，EC₅₀ 为 0.25 nM，比作用于 PI3K (EC₅₀: 200 nM) 选择性高 800 倍。体外酶实验中，Torin 2 还抑制 DNA-PK，IC₅₀ 为 0.5 nM。Torin 2 抑制 mTORC1 和 mTORC2。

别名：9-(6-Amino-3-pyridinyl)-1-[3-(trifluoromethyl)phenyl]-benzo[h]-1,6-naphthyridin-2(1H)-one

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 20 mg/mL (46.25 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Torin 2 是一种有效的选择性 mTOR 抑制剂，在 p53-/- MEFs 细胞系中 IC ₅₀ 为 0.25 nM；作用于 mTOR 比作用于 PI3K 选择性高 800 倍，并且改善了药代动力学性能。抑制 ATM/ATR/DNA-PK，在 PC3 细胞系中 EC ₅₀ 分别为 28 nM/35 nM/118 nM。			
靶点	mTOR (p53-/- MEFs)	ATM (PC3 cells)	ATR (PC3 cells)	DNA-PK (PC3 cells)
	0.25 nM	28 nM(EC ₅₀)	35 nM(EC ₅₀)	118 nM(EC ₅₀)
体外研究	Torin 2 与 PI3Kγ 具有相同的结合模式，V882 作为铰链结合点，在内部疏水袋 Y867，D841 和 D964 再提供三个作用于氨基比林侧链的氢键，类似于 mTOR 的 Y2225，D2195 和 D2357。Torin 2 抑制 mTORC1，因此通过促进其核转运激活 TFEB，EC ₅₀ 为 1.666 mM。Torin 2 (< 50 nM) 引起 MZ-CRC-1 和 TT 细胞的活性显著减少。Torin 2 (100 nM) 使			

	MZ-CRC-1 和 TT 细胞的迁移显著减少。
体内研究	在小鼠肝微粒体稳定性试验中, Torin 2 表现出>95%的药效学响应, 和 11.7 分钟的半衰期。Torin 2 静脉内或口服给药后, 在雄性 Swiss albino 小鼠体内表现出最好的生物利用度(51%), 短的半衰期(0.72 小时)和低清除率(19.6 mL/min/kg)。在 Th-MYCN 小鼠体内, Torin 2(20mg/kg)消除 MYCN 肿瘤, 减少 MYCN 蛋白质水平, 并诱导细胞凋亡。

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)

MB3467	Torin 1
MB3869	GSK2126458 (GSK458)
MB4285	INK 128 (MLN0128)
MB3438	KU-0063794

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。Torin2 是一种高效选择性 atp 竞争性 mTOR 抑制剂。Torin2 的 IC50 为 0.25 nM, 对 mTOR 的选择性是 PI3K 的 800 倍。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.3127 mL	11.5634 mL	23.1267 mL
5 mM		0.4625 mL	2.3127 mL	4.6253 mL
10 mM		0.2313 mL	1.1563 mL	2.3127 mL
50 mM		-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验 :	mTOR 和 PI3K 细胞试验: 对 mTOR 的细胞 IC50 值使用 p53-/- MEFs 测定。细胞用载体或逐渐增减浓度的 Torin 2 处理 1 小时, 然后裂解。S6K1 Thr-389 的磷酸化使用磷酸-特异性抗体进行免疫印迹监测。同时, 对 PI3Ka 的细胞 IC50 值, 在 p53-/-/mLST8-/-MEFs 或表达 S473D 突变体 Akt1 的人 PC3 细胞中, 基于 Akt Thr-308 的磷酸化进行测定。
细胞实验 :	Cell lines: MZ-CRC-1 和 TT 细胞 Concentrations: 50 nM Incubation Time: 3 天或 5 天 Method: 对于活性测定, MZ-CRC-1 和 TT 细胞以一式四份接种在 96 孔板(1.0×10 ⁴ 细胞/孔), 培养基分别包含 2.5%和 4% FBS。24 小时后, 细胞用 Torin 2 处理。在指定时间点, 细胞与 10 μL CellTiter96 AQueous One 溶液在 100 μL 培养基中培育 3 小时, 吸光度在 490 nm 下测量。
动物实验 :	Animal Models: 雄性 Swiss albino 小鼠 Formulation: 首先以 25 mg/mL 溶解在 100% N-甲基-2-吡咯烷酮中, 然后以 1:4 用无菌 50% PEG400 稀释, 再用于注射 Dosages: 25 mg/kg Administration: 静脉内或口服给药

【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。