

Selitrectinib (LOXO-195)

产品编号: MB3582

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C20H21FN6O	结构式	
分子量	380.42		
CAS No.	2097002-61-2		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H2O : Insoluble		
	DMSO: 38 mg/mL (99.89 mM)		
	Ethanol: 15 mg/mL (39.43 mM)		
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: Selitrectinib (LOXO-195)是一种具有口服活性、高度有效的、选择性 TRK 激酶抑制剂, 对 TRKA G595R、TRKC G623R 和 TRKA G667C 的 IC50 值为 2-9.8 nM。它对靶点的选择性是对其他 98%所检测的非 TRK 激酶的 1000 倍以上。

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H2O : Insoluble; Ethanol: 15 mg/mL (39.43 mM); DMSO: 38 mg/mL (39.43 mM)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	Selitrectinib (LOXO-195)是一种具有口服活性、高度有效的、选择性 TRK 激酶抑制剂, 对 TRKA G595R、TRKC G623R 和 TRKA G667C 的 IC50 值为 2-9.8 nM。它对靶点的选择性是对其他 98%所检测的非 TRK 激酶的 1000 倍以上。				
IC50 & Target	WTTRKA (Cell-free assay)	TRKAG595R (Cell-free assay)	TRKCG623R (Cell-free assay)	WTTRKC (Cell-free assay)	TRKCG696A (Cell-free assay)
	0.6 nM	2 nM	2.3 nM	2.5 nM	2.5 nM
体外	LOXO-195 在体外能有效地抑制不同的活化 TRK 激酶。在浓度为 1 μM 时, LOXO-195 对目标靶点的选择性比对 98%其他检测激酶 (库中包含 228 种激酶) 高 1000 倍以上。在包含 TRK 融合的 KM12、CUTO-3 和 O-91 细胞系中, LOXO-195 能有效地抑制其细胞增殖(IC50 ≤				

	5 nmol/L)。而在不包含 TRK 融合的 84 种细胞系中，浓度即使高达 10 μ M 的 LOXO-195 对细胞生长也没有抑制作用。
体内	在由 Δ TRKA 驱动的肿瘤中，LOXO-195 有效地减少磷酸化 TRKA 水平。在四种依赖于 TRKA 的肿瘤模型中（通过接种包含 NIH 3T3 Δ TRKA, Δ TRKA G595R, Δ TRKA G667C 和 TPM3-NTRK1 融合的 KM12 细胞构建的肿瘤模型），LOXO-195 可引起肿瘤生长抑制作用。

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)

MB3277	LOXO-101
MB3583	Larotrectinib (LOXO-101) sulfate
MB3916	GW441756

储液配置及储存：按表中溶解性配置；如溶解困难，可以通过快速搅拌，超声或温和加热（在 45-60°C 下水浴）。液体稳定性报道的很少，建议现配现用，如需储存，建议：-20°C 1-3 月；-80°C 3-6 月。

体 积 浓度	DMSO 质量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6287 mL	13.1434 mL	26.2867 mL
5 mM	0.5257 mL	2.6287 mL	5.2573 mL
10 mM	0.2629 mL	1.3143 mL	2.6287 mL
50 mM	0.0526 mL	0.2629 mL	0.5257 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，否则会严重影响化合物活性，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, 使产品沉降到管底。对于液体产品, 可以在 200 转左右稍作离心, 管底收集液体, 从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差, 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。