

Larotrectinib (LOXO-101) sulfate

产品编号: MB3583

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5mg/25mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C ₂₁ H ₂₂ F ₂ N ₆ O ₂ .H ₂ SO ₄	结 构 式	
分子量	526.51		
CAS No.	1223405-08-0		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H ₂ O : Insoluble		
	DMSO: 100 mg/mL (189.93 mM)		
	Ethanol: 100 mg/mL (189.93 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: Larotrectinib (LOXO-101) sulfate 是一种可口服的、选择性的、ATP 竞争性的原肌球蛋白受体激酶 TRK 的有效抑制剂。

别名: ARRY-470, Larotrectinib

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H₂O : Insoluble; Ethanol: 100 mg/mL (189.93 mM); DMSO: 100 mg/mL (189.93 mM)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	Larotrectinib (LOXO-101) sulfate 是一种可口服的、选择性的、ATP 竞争性的原肌球蛋白受体激酶 TRK 的有效抑制剂。
IC50 & Target	TRK ()
体外	ARRY-470(LOXO-101)是一种选择性的激酶抑制剂, 对 TRKA、TRKB 和 TRKC 具有摩尔级别的活性, 而对其他激酶的抑制活性都大于 1000 nM。ARRY-470 并不对表达其他致癌基因(上皮生长因子受体 EGFR、ALK 或 ROS1)的 Ba/F3 细胞具有增殖抑制的作用、对来自于肺和结肠的不具有 NTRK1 融合的细胞系也没有此作用。ARRY-470(LOXO-101)能诱导 KM12 细胞的凋亡并将细胞周期阻滞在 G1 期。

体内	早期持续的 ARRY-470(LOXO-101) 的给药在荷瘤骨中能够显著地减弱骨癌疼痛、抑制感觉神经纤维的异位发芽以及类似神经瘤的结构形成。但对肿瘤生长和骨骼重建没有显著效果。ARRY-470(LOXO-101)跨越血脑屏障的能力非常有限。
细胞实验	Cell lines: Ba/F3 细胞 Concentrations: 10, 100, 1000 nM Incubation Time: 5 h Method: 表达 MPRIP-NTRK1 (RIP-TRKA)或 EV 的 Ba/F3 细胞用药物 (DMSO; ARRY-470; G, gefitinib 1,000 nM) 处理 5 小时后进行裂解, 然后进行 Werstern blot 分析。 (Only for Reference)
动物实验	Animal Models: C3H/HeJ 成年雄性小鼠 Formulation: Labrafac;多糖醇解的甘油酯 Dosages: 10-100 mg/kg Administration: 口服 (Only for Reference)

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
MB3582	Selitrectinib (LOXO-195)
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 DMSO 质量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8993 mL	9.4965 mL	18.9930 mL
5 mM	0.3799 mL	1.8993 mL	3.7986 mL
10 mM	0.1899 mL	0.9496 mL	1.8993 mL
50 mM	0.0380 mL	0.1899 mL	0.3799 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。