

Encorafenib (LGX818)

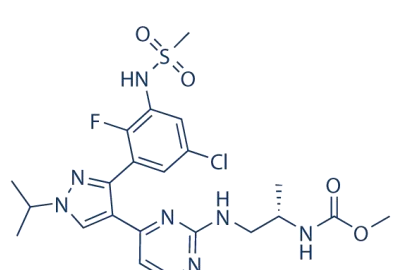
产品编号: MB3600

质量标准: >98%,BR

包装规格: 1mg/5mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C22 H27 Cl F N7 O4 S	结构式	
分子量	540.01		
CAS No.	1269440-17-6		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H2O : Insoluble		
	DMSO: 100 mg/mL (185.18 mM)		
	Ethanol: 100 mg/mL (185.18 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: Encorafenib (LGX818)是高效的 RAF 抑制剂, 作用于表达 B-RAF(V600E)的细胞, 具有选择性的抗增殖和凋亡活性, EC50 为 4 nM。Phase 3。

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H2O : Insoluble; Ethanol: 100 mg/mL (185.18 mM); DMSO: 100 mg/mL (185.18 mM)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	Encorafenib (LGX818)是高效的 RAF 抑制剂, 作用于表达 B-RAF(V600E)的细胞, 具有选择性的抗增殖和凋亡活性, EC50 为 4 nM。Phase 3。	
特性	LGX818 是有效的选择性 RAF 激酶抑制剂, 对野生型 BRAF 几乎没有作用活性。	
IC50 & Target	B-Raf (V600E)	
体外	LGX818 处理 A375 (BRAfV600E) 人黑色素瘤细胞系, 抑制 phospho-ERK (EC50=3 nM), 有效抑制增殖(EC50 = 4 nM)。LGX818 作用于一组 100 种激酶(IC50>900 nM) 没有显著作用活性, LGX818 不抑制 400 多种表达野生型 BRAF 的细胞系。在生化实验中, 解离半衰期>24 小时转化为持续的靶点抑制, 随后药物被洗出。	

体内	<p>在单剂量 PK/PD 研究中, LGX818 按 6 mg/kg 低剂量口服处理人黑色素移植瘤模型 (BRAV600E), 强效(75%)且持久(24 小时以上)降低 phospho-MEK。LGX818 按 1 mg/kg 低剂量处理免疫受损小鼠和大鼠, 作用于多种 BRAF 突变的人类移植瘤模型, 诱导肿瘤消退。与体外数据相一致, LGX818 对 BRAF 野生型肿瘤是无作用活性的, 即使每天两次剂量高达 300mg/kg, 具有良好的耐受性和线性增长。LGX818 作用于更多疾病相关的自发转移性黑色素瘤和黑色素瘤脑转移模型, 也具有作用效果。LGX818 是一种有效的选择性 RAF 激酶抑制剂, 具有独特的生化特性。</p>
----	---

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)

MB3602	LY03009120
MB3922	CEP-32496
MB4072	ZM 336372

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	1.8518 mL	9.2591 mL	18.5182 mL
5 mM	0.3704 mL	1.8518 mL	3.7036 mL
10 mM	0.1852 mL	0.9259 mL	1.8518 mL
50 mM	0.0370 mL	0.1852 mL	0.3704 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。如需制备储备液, 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。