

LY03009120

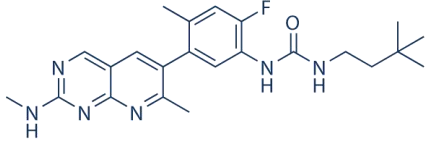
产品编号: MB3602

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C23H29FN6O	结构式	
分子量	424.51		
CAS No.	1454682-72-4		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H2O : Insoluble		
	DMSO: 20 mg/mL (47.11 mM) (warmed with 50℃ water bath)		
	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: LY03009120 是一种有效的泛 Raf 抑制剂, 在 A375 细胞中对 A-raf, B-Raf, 和 C-Raf 的 IC50 分别为 44 nM, 31-47 nM, 和 42 nM。Phase 1。

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H2O : Insoluble; Ethanol: Insoluble; DMSO: 20 mg/mL (47.11 mM) (warmed with 50℃ water bath)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	LY03009120 是一种有效的泛 Raf 抑制剂, 在 A375 细胞中对 A-raf, B-Raf, 和 C-Raf 的 IC50 分别为 44 nM, 31-47 nM, 和 42 nM。Phase 1。		
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	C-Raf (Cell-free assay)	BRAF(V600E) (Cell-free assay)	BRAF WT (Cell-free assay)
	4.3 nM	5.8 nM	15 nM
体外	LY3009120 抑制 A375 和 HCT116 细胞的生长, IC50 分别为 9.2 和 220 μM。LY3009120 抑		

	制酪氨酸激酶 KDR, IC50 为 3.9 μM 。
体内	在负荷 BRAF V600E ST019VR PDX 肿瘤的大鼠体内, LY3009120 (15 or 30 mg/kg, p.o.) 剂量依赖性抑制肿瘤生长。在负荷 A375 异种移植物的裸鼠体内, LY3009120 (3 到 50 mg/kg, p.o.) 单剂量口服治疗剂量依赖性抑制磷酸-ERK, 4.36 mg/kg 剂量下抑制 50% 磷酸- ERK (EC50), 68.9 ng/mL 或 165 nM 血浆浓度下达到 50% 磷酸- ERK (EC50) 抑制率。
激酶实验	使用 KiNativ 试验测定激酶活性: 化合物在 A375 细胞裂解物中使用基于 ATP 的探针在 5 μM 下筛选。IC50 值以微摩尔单位表示。细胞沉淀重悬浮在 4 体积裂解缓冲液[25 mM Tris pH 7.6, 150 mM NaCl, 1% CHAPS, 1% Tergitol NP-40 型, 1% v/v 磷酸酶抑制剂混合物 II]中, 使用尖端超声波仪声处理, 并均质化。裂解产物通过 100,000 g 下离心分离 30 分钟除去。澄清的裂解液通过 0.22 μM 注射过滤器和凝胶过滤到反应缓冲液[20 mM Hepes pH 7.8, 150 mM NaCl, 0.1% triton X-100, 1% v/v 磷酸酶抑制剂混合物 II]。抑制剂处理和探针标记之前, 将终浓度为 20 mM 的 MnCl ₂ 加入裂解液。用于 IC50 测定的终抑制剂浓度为 10, 1, 0.1, 和 0.01 μM 。ATP 竞争性实验在 1,000, 100, 10, 和 1 μM ATP 下进行。所有抑制剂的处理在室温下进行。
细胞实验	Cell lines: A375 和 HCT116 细胞 Concentrations: 0.51 μM Incubation Time: 67 h Method: 简而言之, 细胞在 DMEM 高浓度葡萄糖中生长, 用 10% 胎牛血清和 1% 青霉素/链霉素/L-谷氨酰胺增补, 在 37°C, 5% CO ₂ , 和 95% 湿度下培育。允许细胞扩增到 70-95% 的融合度。连续稀释的测试化合物分配加入到 384 孔黑色透明底板。每孔加入包含 625 个细胞的 50 μL 完全生长培养基。板在 37°C, 5% CO ₂ , 和 95% 湿度下培育 67 小时。然后, 10 μL 包含 440 μM 刃天青的 PBS 溶液加入板的每孔中, 板在 37°C, 5% CO ₂ , 和 95% 湿度下再培育 5 小时。板在 Synergy2 阅读器上使用 540 nm 激发波长和 600 nm 发射波长读取。得到的数据使用 Prism 软件分析以计算 IC 50 值。 (Only for Reference)
动物实验	Animal Models: 负荷 BRAF V600E ST019VR PDX 肿瘤的雌性 NIH 裸鼠 Formulation: 20% 环糊精, 25 mM 磷酸盐, pH2.0 Dosages: 30 mg/kg Administration: p.o. (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)

MB3600	Encorafenib (LGX818)
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	2.3557 mL	11.7783 mL	23.5566 mL
5 mM	0.4711 mL	2.3557 mL	4.7113 mL
10 mM	-	-	-

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做好预处理，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。