

Ceritinib ; LDK-378 ; 色瑞替尼 ; LDK378

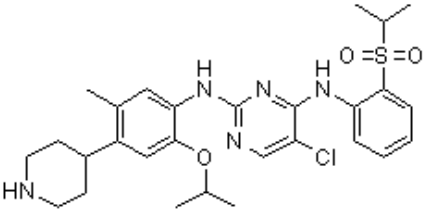
产品编号 : MB5665

质量标准 : >98%,ALK 抑制剂

包装规格 : 10MG;100MG;1G

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₈ H ₃₆ ClN ₅ O ₃ S	结 构 式	
分子量	558.14		
CAS No.	1032900-25-6		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 20 mg/mL warmed (35.83 mM) Water : Insoluble Ethanol : 3 mg/mL (5.37 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 : 色瑞替尼 Ceritinib (LDK378) 是有效且特异性的 ALK 抑制剂。**别名 :** LDK378 ; 2,4-Pyrimidinediamine, 5-chloro-N4-[2-[(1-methylethyl)sulfonyl]phenyl]-N2-[5-methyl-2-(1-methylethoxy)-4-(4-piperidinyl)phenyl]-**物理性状及指标 :**

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 20 mg/mL warmed (35.83 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 3 mg/mL (5.37 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20℃, 避光防潮密闭干燥**生物活性**

产品描述	Ceritinib (LDK378)是一种有效的 ALK 抑制剂, 在无细胞试验中 IC ₅₀ 为 0.2 nM, 与作用于 IGF-1R 和 InsR 相比, 选择性分别高 40 和 35 倍。
特性	不与 c-Met 交叉反应, 对体内葡萄糖稳态比 TAE684 效果好, 有效作用于 Crizotinib 复发的肿瘤。

靶点	ALK (Cell-free assay)	Insulin Receptor (Cell-free assay)	IGF-1R (Cell-free assay)
	0.2 nM	7 nM	8 nM
体外研究	LDK378 作用于 Ba/F3-NPM-ALK 和 Karpas290 细胞，具有显著的抗增殖活性，IC50 分别为 26.0 nM 和 22.8 nM,作用于 Ba/F3-Tel-InsR 和 Ba/F3-WT 细胞，IC50 分别为 319.5 nM 和 2477 nM。		
体内研究	LDK378 用于降低形成反应代谢的可能性，在肝微粒体几乎检测不到谷胱甘肽 (GSH) 加合物的水平 (<1%)。LDK378 具有相对良好的代谢稳定性，中度抑制 CYP3A4 (Midazolam 底物) 和抑制 hERG。LDK378 处理动物，与肝脏血流量相比，具有低的血浆清除率 (小鼠，大鼠，狗和猴)，处理小鼠，大鼠，狗和猴的口服生物利用度都在 55% 以上。LDK378 处理 Karpas299 和 H2228 大鼠移植瘤模型，抑制肿瘤生长，诱导肿瘤衰退，这种作用具有剂量依赖性，体重没有降低。LDK378 处理小鼠，剂量高达 100 mg/kg，对胰岛素水平或血浆葡萄糖的利用无影响。		

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)

MB3330	PF-06463922
MB4539	RXDX-101
MB3641	SD-208

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。本品色瑞替尼 Ceritinib (LDK378) 是有效且特异性的 ALK 抑制剂，可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7917 mL	8.9583 mL	17.9167 mL
5 mM	0.3583 mL	1.7917 mL	3.5833 mL
10 mM	0.1792 mL	0.8958 mL	1.7917 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	激酶分析: 所有激酶使用杆状病毒表达技术表达为组氨酸或 GST 标签的融合蛋白，除了在大肠杆菌中产生
------	--

	的未标记的 ERK2。在 LabChip 迁移实验中测量激酶活性。实验在 30°C 下进行 60 分钟。在有或无 LDK378 存在时，通过线性进展曲线，获得 LDK378 对酶活性的作用效果。
细胞实验	<p>Cell lines: Ba/F3-NPM-ALK, Ba/F3-Tel-InsR, Ba/F3-WT, Karpas299 细胞</p> <p>Concentrations: ~100 μM</p> <p>Incubation Time: 2-3 天</p> <p>Method: 表达荧光素酶的细胞与连续稀释的 LDK378 或 DMSO 温育 2-3 天。荧光素酶的表达用来衡量细胞增殖/存活，使用 Bright-Glo 荧光素酶检测系统来评估。使用 XLFit 软件获得 IC50 值。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 Karpas299/H2228 肿瘤的 RNU 裸鼠</p> <p>Formulation: LDK378 (磷酸盐形式)在 0.5% 甲基纤维素/0.5% Tween 80 中制备</p> <p>Dosages: ~50 mg/kg</p> <p>Administration: 口服饲喂</p>

【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。