

Repotrectinib (瑞普替尼)

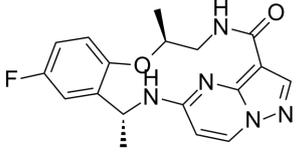
产品编号: MC8019

质量标准: >99%, BR

包装规格: 1mg / 5mg / 10mg / 50mg

产品形式: 固体

基本信息:

分子式	C ₁₈ H ₁₈ FN ₅ O ₂	结 构 式	
分子量	355.37		
CAS No.	1802220-02-5		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
运输条件	湿冰运输 (按季节)		

简介: Repotrectinib 是一种潜在的同类最佳的低分子量大环结构的酪氨酸激酶抑制剂, 对 ROS1 (IC₅₀=0.07nM) 和 TRK (对 TRKA/B/C 的 IC₅₀=0.83/0.05/0.1nM) 具有高度选择性。Repotrectinib 可以有效抑制 WT ALK (IC₅₀=1.01 nM)。

别名: TPX-0005

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 25mg/mL; 水中不溶

有机溶剂残留:符合 ICH 及中国药典规定

纯度:>99%

用途及描述: 科研试剂, 仅限应用于分子生物学、药理学等科研方面, 严禁用于人体。Repotrectinib 是 ALK/ROS1/TRK 抑制剂, 也是新一代的广谱抗癌药。临床证实其效力比克唑替尼高 90 倍。并且能够克服多种对其它 TKI 产生抗性的基因突变, 杀死携带 ROS1 或 NTRK 基因融合的多种肿瘤细胞, 因而有潜力治疗 ROS1 阳性的非小细胞肺癌, 具有惊人的入脑效果。

生物活性:

靶点	TrkA
体外研究	Repotrectinib 抑制突变体 ALK, 包括 ALK G1202R(IC ₅₀ =1.26nM) 和 ALK L1196M (IC ₅₀ =1.08nM)。Repotrectinib 还抑制多种其他激酶, 包括 JAK2、LYN、Src 和 FAK (IC ₅₀ =1.04、1.66、5.3 和 6.96nM) ^[1] 。 Repotrectinib 有效地克服了这种原发性耐药性(细胞增殖试验中 IC ₅₀ =100nM), 强烈抑制 EML4-ALK 的磷酸化(IC ₅₀ =13nM)和 SRC 底物桩蛋白(IC ₅₀ =107nM)。Repotrectinib 在伤口愈合试验中抑制 H2228 细胞迁移, 其活性与 saracatinib 相似 ^[1] 。
体内研究	Repotrectinib 在 ALK WT 和 ALK G1202R 异种植物中有效抑制体内肿瘤生长 ^[1] 。

溶液配制:

制备储备液	溶剂体积	质量	1mg	5mg	10mg
	浓度				



	1mM	2.8140 mL	14.0698 mL	28.1397 mL
	5mM	0.5628 mL	2.8140 mL	5.6279 mL
	10mM	0.2814 mL	1.4070 mL	2.8140 mL

使用方法：（仅供参考）

- 1、储存液的配制，用于细胞培养相关实验：按照基本信息表格中溶解性进行溶解，如用于细胞实验，请配制成为液体之后用 0.22 μ m 过滤后再加入细胞。
- 2、储存液的保存：建议现配现用，液体不是很稳定；也可分装成单次用量，2 年稳定。避免反复冻融。

【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（如 0.22 μ m 滤膜过滤），除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 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。
- 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。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 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。

参考文献

[1]. Dayong Zhai, et al. Abstract 2132: The novel, rationally-designed, ALK/SRC inhibitor TPX-0005 overcomes multiple acquired resistance mechanisms to current ALK inhibitors. Cancer Research. July 2016.

S241001

