

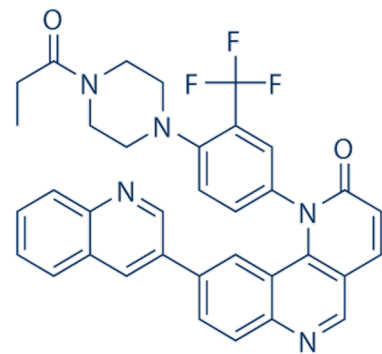
Torin 1 (mTOR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0245-10mM	Torin 1 (mTOR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0245-5mg	Torin 1 (mTOR抑制剂)	5mg
SC0245-25mg	Torin 1 (mTOR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	1-[4-(4-propanoylpiperazin-1-yl)-3-(trifluoromethyl)phenyl]-9-quinolin-3-ylbenzo[h][1,6]naphthyridin-2-one
简称	Torin 1
别名	Torin 1 cpd, Torin1, Torin-1
中文名	N/A
化学式	C ₃₅ H ₂₈ F ₃ N ₅ O ₂
分子量	607.62
CAS号	1222998-36-8
纯度	99.0%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 20mg/ml warmed; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.82ml DMSO, 或每6.08mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0245-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Torin 1是一种有效的mTORC1/2抑制剂, 在无细胞试验中IC50为2nM/10nM; 作用于mTOR比作用于PI3K选择性高1000倍。				
信号通路	PI3K/Akt/mTOR				
靶点	mTORC1	mTOR	DNA-PK	mTORC2	p110γ
IC50	2nM	4.32nM	6.34nM	10nM	171nM
体外研究	Torin 1在2和10nM浓度下分别抑制mTORC1和mTORC2底物的磷酸化。此外, Torin 1对mTOR比对PI3K(EC50=1800nM)的选择性高1000倍, 比对450种其它蛋白激酶的结合选择性高100倍。Torin 1通过耐rapamycin机制引起细胞周期阻滞, 并且其不依赖于mTORC2。Torin 1比rapamycin更完全地干扰mTORC1依赖表现型。Cap依赖性翻译需要mTORC1耐Rapamycin的功能。在近期的一项研究中, 据报道Torin 1通过活化人内分泌细胞系BON中MEK/ERK/c-Jun通路, 能够增加神经降压素分泌和基因表达。				
体内研究	Torin 1在20mg/kg剂量下, 在U87MG异种移植模型中是有效的, 并且在肿瘤和外周组织中对mTOR下游效应蛋白表现出良好的药效学抑制作用。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	为产生可溶性mTORC1, HEK-293T细胞系, 稳定表达N端FLAG标记的Raptor, 使用水泡性口炎病毒G-假型病毒MSCV逆转录酶病毒产生。对于mTORC2, 产生相似的HeLa细胞, 能够稳定表达N端FLAG-标记的Protor-1。两个复合物通过在50mM HEPES(pH7.4)、10mM焦磷酸钠、10mM β-甘油磷酸钠、100mM NaCl、2mM EDTA、0.3% CHAPS中裂解细胞纯化。细胞在4°C下裂解30分钟, 不溶解部分通过以13,000rpm微量离心10分钟移除。上清液与FLAG-M2单克隆抗体-琼脂糖培育1小时, 然后用裂解缓冲液洗涤3次, 用包含终浓度0.5M NaCl的裂解缓冲液洗涤1次。纯化的mTORC1用100μg/ml 3×FLAG多肽在50mM HEPES(pH7.4)、100mM NaCl中洗脱。将洗出液等分收集, 储存在-80°C。纯化底物S6K1和Akt1。激酶试验在30°C, 由激酶缓冲液(25mM HEPES(pH7.4)、50mM KCl、10mM MgCl ₂ 、500μM ATP)和150ng灭活的S6K1或Akt1底物组成的20μl终体积混合物中进行。反应通过加入80μl样品缓冲液停止,

	并煮沸5分钟。随后，样品通过SDS-PAGE和免疫印迹法分析。
--	---------------------------------

细胞实验	
细胞系	MEFs
浓度	~250nM
处理时间	4天
方法	细胞活性通过CellTiter-Glo发光法细胞活性测定评估。在第0天，细胞以500细胞每孔接种到96孔板，并生长过夜。第1天，细胞用适当的化合物处理，随后在第3-5天分析。对于分析，板在室温下培育60分钟，将50µl CellTiter-Glo试剂加入每孔中，板在定轨摇床上混合12分钟。发光在标准平板光度计上定量。

动物实验	
动物模型	U87MG异种移植物模型
配制	Torin 1粉末首先以25mg/ml在100% N-甲基-2-吡咯烷酮中溶解，随后以1:4与无菌50% PEG400稀释到5mg/ml的终浓度
剂量	20mg/kg
给药方式	腹腔注射给药，每天一次

➤ **参考文献:**

- 1.Thoreen CC, et al. J Biol Chem. 2009; 284(12):8023-8032.
- 2.Liu Q, et al. J Med Chem. 2010; 53(19):7146-7155.
- 3.Dowling RJ, et al. Science. 2010; 328(5982):1172-1176.
- 4.Li J, et al. Am J Physiol Cell Physiol. 2011; 301(1):C213-C226.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0245-10mM	Torin 1 (mTOR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0245-5mg	Torin 1 (mTOR抑制剂)	5mg
SC0245-25mg	Torin 1 (mTOR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.02.09