

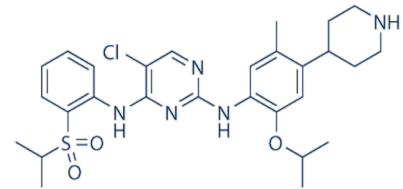
Ceritinib (ALK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5292-10mM	Ceritinib (ALK抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5292-5mg	Ceritinib (ALK抑制剂)	5mg
SF5292-25mg	Ceritinib (ALK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	5-chloro-2-N-(5-methyl-4-piperidin-4-yl-2-propan-2-yloxyphenyl)-4-N-(2-propan-2-ylsulfonylphenyl)pyrimidine-2,4-diamine
简称	Ceritinib
别名	LDK378, ZYKADIA, Eritinib (LDK378), NVP-LDK378-NX
中文名	色瑞替尼
化学式	C ₂₈ H ₃₆ ClN ₅ O ₃ S
分子量	558.14
CAS号	1032900-25-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 20mg/ml warming; Ethanol 3mg/ml
溶液配制	5mg加入0.90ml DMSO, 或每5.58mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5292-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

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0.2nM, 与作用于IGF-1R和InsR相比, 选择性分别高40和35倍。Phase 3。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	ALK	Insulin Receptor	IGF-1R	STK22D	FLT3
IC ₅₀	0.2nM	7nM	8nM	23nM	60nM
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, IC ₅₀ 分别为26.0nM和22.8nM, 作用于Ba/F3-Tel-InsR 和Ba/F3-WT细胞, IC ₅₀ 分别为319.5nM和2477nM。				
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100mg/kg, 对胰岛素水平或血浆葡萄糖的利用无影响。				
临床实验	N/A				
特征	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。				

➤ 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	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	
细胞系	Ba/F3-NPM-ALK, Ba/F3-Tel-InsR, Ba/F3-WT, Karpas299细胞
浓度	~100μM

处理时间	2-3天
方法	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。

动物实验	
动物模型	携带Karpas299/H2228肿瘤的RNU裸鼠
配制	LDK378(磷酸盐形式)在0.5%甲基纤维素/0.5% Tween 80中制备
剂量	~50mg/kg
给药方式	口服饲喂

➤ 参考文献:

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF5292-10mM	Ceritinib (ALK抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5292-5mg	Ceritinib (ALK抑制剂)	5mg
SF5292-25mg	Ceritinib (ALK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:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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淀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、体内研究结果或其他相关文献，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的等效剂量转换表请参考如下网页：

<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01