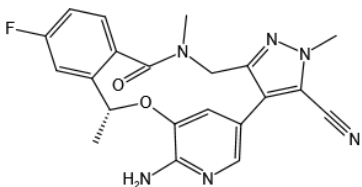


Lorlatinib

产品简介

Lorlatinib, 又称劳拉替尼, 是可口服的 ALK/ROS1 抑制剂, 作用于 ROS1、ALK-WT 以及 ALK-L1196M 的 K_i 值分别为 <0.02 nM、 <0.07 nM 和 0.7 nM, 具有较强的血脑屏障透过能力, 可诱导癌细胞凋亡, 表现出显著的抗肿瘤活性, 临床上用于治疗非小细胞肺癌。

产品信息

英文别名 (English Synonym)	Lorlatinib, PF-06463922, PF06463922
中文名称 (Chinese Name)	劳拉替尼
靶点 (Target)	ALK, ROS1
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase--Anaplastic lymphoma kinase (ALK)
CAS 号 (CAS NO.)	1454846-35-5
分子式 (Formula)	$C_{21}H_{19}FN_6O_2$
分子量 (Molecular Weight)	406.41
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO
结构式 (Structure)	

组分信息

组分名称	54573ES08/54573ES25
Lorlatinib	5 mg/25 mg

储存条件

-25°C ~ -15°C 保存, 有效期 3 年。

使用方法

【数据来自于公开发表的文献, 仅供参考, 具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

1、细胞实验 (体外实验)

在表达 SLC34A2-ROS1 融合物的 HCC78 细胞和表达人 CD74-ROS1 的 BaF3-CD74-ROS1 细胞中, PF-06463922 显著抑制细胞增殖, 并诱导细胞凋亡。^[2]

2、动物实验 (体内实验)

在大鼠体内, PF-06463922 显示出低血浆清除率, 适度的分布容积, 合理的半衰期, 生物利用度为 100%。^[1] 在体内,

注意事项

1. 本产品仅作科研用途。
2. 为了您的安全和健康，请穿实验服并佩戴一次性手套操作。
3. 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
4. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。

参考文献

- [1] Johnson TW, Richardson PF, Bailey S, et al. Discovery of (10R)-7-amino-12-fluoro-2,10,16-trimethyl-15-oxo-10,15,16,17-tetrahydro-2H-8,4-(metheno)pyrazolo[4,3-h][2,5,11]-benzoxadiazacyclotetradecine-3-carbonitrile (PF-06463922), a macrocyclic inhibitor of anaplastic lymphoma kinase (ALK) and c-ros oncogene 1 (ROS1) with preclinical brain exposure and broad-spectrum potency against ALK-resistant mutations. *J Med Chem*. 2014 Jun 12;57(11):4720-44. doi: 10.1021/jm500261q(IF:6.054).
- [2] Zou HY, Li Q, Engstrom LD, et al. PF-06463922 is a potent and selective next-generation ROS1/ALK inhibitor capable of blocking crizotinib-resistant ROS1 mutations. *Proc Natl Acad Sci U S A*. 2015 Mar 17;112(11):3493-8. doi: 10.1073/pnas.1420785112(IF:9.58).