



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Pirtobrutinib**
CAS 号: **2101700-15-4**
产品货号: **S89858**

生物活性:

Description	Pirtobrutinib (LOXO-305), a highly selective and non-covalent next generation BTK inhibitor, inhibits diverse BTK C481 substitution mutations. Pirtobrutinib causes regression of BTK-dependent lymphoma tumors in mouse xenograft models. Pirtobrutinib is also more than 300-fold selective for BTK versus 370 other kinases tested and shows no significant inhibition of non-kinase off-targets at 1 μ M[1].			
In Vitro	Pirtobrutinib 以纳摩尔的效力有效抑制野生型 BTK 和 BTK C481S 介导的激酶活性。Pirtobrutinib 抑制 WT BTK (Y223) 自磷酸化, IC50 为 3.68 nM。Pirtobrutinib 抑制 BTK C481S Y223、C481T Y223 和 C481R Y223 自磷酸化, IC50 分别为 8.45、7.23 和 11.73 nM[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (104.29 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.0858 mL	10.4291 mL
		5 mM	0.4172 mL	2.0858 mL
		10 mM	0.2086 mL	1.0429 mL
* 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (stored under nitrogen)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.75 mg/mL (5.74 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.75 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 27.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.75 mg/mL (5.74 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.75 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 27.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。				



	方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 以下溶解方案，请直接配制工作液。建议现用现配，在短期内尽快用完。 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比； 如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶。 方案 一 请依序添加每种溶剂： 50% PEG300 → 50% Saline Solubility: 10 mg/mL (20.86 mM); 悬浊液; 超声助溶
参考文献	[1]. Gomez E B , et al. Loxo-305, a Highly Selective and Non-Covalent Next Generation BTK Inhibitor, Inhibits Diverse BTK C481 Substitution Mutations[J]. Blood, 2019, 134(Supplement_1):4644-4644.

完整储备液配制表：

* 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限：-80℃, 6 months; -20℃, 1 month (stored under nitrogen)。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.0858 mL	10.4291 mL	20.8581 mL	52.1453 mL
	5 mM	0.4172 mL	2.0858 mL	4.1716 mL	10.4291 mL
	10 mM	0.2086 mL	1.0429 mL	2.0858 mL	5.2145 mL
	15 mM	0.1391 mL	0.6953 mL	1.3905 mL	3.4764 mL
	20 mM	0.1043 mL	0.5215 mL	1.0429 mL	2.6073 mL
	25 mM	0.0834 mL	0.4172 mL	0.8343 mL	2.0858 mL
	30 mM	0.0695 mL	0.3476 mL	0.6953 mL	1.7382 mL
	40 mM	0.0521 mL	0.2607 mL	0.5215 mL	1.3036 mL
	50 mM	0.0417 mL	0.2086 mL	0.4172 mL	1.0429 mL
	60 mM	0.0348 mL	0.1738 mL	0.3476 mL	0.8691 mL
	80 mM	0.0261 mL	0.1304 mL	0.2607 mL	0.6518 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	100 mM	0.0209 mL	0.1043 mL	0.2086 mL	0.5215 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶