

Torin 2

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53239ES08	5 mg
Torin 2	53239ES10	10 mg
	53239ES50	50 mg

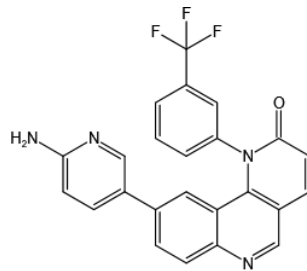
产品描述

Torin 2 (Torin2)是一种可口服的 mTOR 选择性抑制剂, EC₅₀ 为 0.25 nM, 比对 PI3K 和其它蛋白激酶的选择性高 800 倍。Torin 2 还能抑制抑制 ATM/ATR/DNA-PK。Torin2 比 Torin1 更易生产, 药代动力学特性也有改善, 在体内具有良好的利用率。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Torin 2, Torin2
靶点 (Target)	mTORC1/2, PI3K, DNA-PK, ATM, ATR
通路 (Pathway)	PI3K/Akt/mTOR--mTOR
CAS 号 (CAS NO.)	1223001-51-1
分子式 (Formula)	C ₂₄ H ₁₅ F ₃ N ₄ O
分子量 (Molecular Weight)	432.4
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

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

使用浓度

【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。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

Torin 2 对 mTOR, DNA-pK, p110 γ , hVPS34, PI4K β , PI3K-C2 β 和 PI3K-C2 α 的 IC₅₀ 分别为 2.81 nM、0.5 nM、5.67 nM、8.58 nM、18.3 nM、24.5 nM 和 28.1 nM。^[1] Torin 2 对 PIKK 家族激酶具有有效生化和细胞活性, 包括 ATM (EC₅₀: 28 nM), ATR (EC₅₀: 35 nM)和 DNA-PK (EC₅₀:118 nM)。Torin 2 有效抑制 Akt 的 T308, 它是 PDK1 的直接底物和 PI3K 的间接底物, EC₅₀ 小于 10 nM。^[2] Torin 2 (< 50 nM)抑制 MZ-CRC-1 和 TT 细胞的活性。Torin 2 (100 nM)使 MZ-CRC-1 和 TT 细胞的迁移显著减少。^[3]

(二) 动物实验 (体内实验)

在小鼠肝微粒体稳定性实验中, Torin 2 表现出>95%的药效学响应和 11.7 min 的半衰期。Torin 2 静脉注射或口服给药后, 在雄性 Swiss Albino 小鼠体内表现出最好的生物利用度(51%), 短半衰期(0.72 h)和低清除率(19.6 mL/min/kg)。^[1] 在 KRAS 突变的肺癌小鼠中, 单独给药 Torin 2 强烈抑制 pS6K (T389)和 p4EBP1 (T37/46), 并部分抑制 pAkt (T308), 联合给药 Torin 2 (40 mg/kg)和 AZD6244 (25 mg/kg)显著抑制肿瘤生长。^[2]

参考文献

- [1]. Liu Q, et al. Discovery of 9-(6-aminopyridin-3-yl)-1-(3-(trifluoromethyl)phenyl)benzo[h][1,6]naphthyridin-2(1H)-one (Torin2) as a potent, selective, and orally available mammalian target of rapamycin (mTOR) inhibitor for treatment of cancer. J Med Chem. 2011 Mar 10;54(5):1473-80.
- [2]. Liu Q, et al. Characterization of Torin2, an ATP-competitive inhibitor of mTOR, ATM, and ATR. Cancer Res. 2013 Apr 15;73(8):2574-86.
- [3]. Tamburrino A, et al. Activation of the mTOR pathway in primary medullary thyroid carcinoma and lymph node metastases. Clin Cancer Res. 2012 Jul 1;18(13):3532-40.
- [4]. Wang X, et al. mTORC signaling in hematopoiesis. Int J Hematol. 2016 May;103(5):510-8.