

Peficitinib ; ASP015K

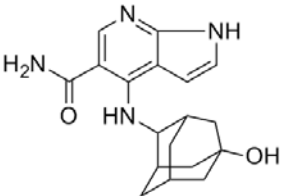
产品编号：MB2614

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG；25MG

产品形式：淡黄色至黄色固体

基本信息

分子式	C18H22N4O2	结 构 式	
分子量	326.39		
CAS No.	944118-01-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 65 mg/mL (199.14 mM) Water Insoluble Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：Peficitinib 是一种可口服的 JAK 抑制剂，对 JAK1、JAK2、JAK3 和 Tyk2 的 IC₅₀ 值分别为 3.9、5.0、0.7 和 4.8 nM。

别名：ASP015K; JNJ-54781532；1H-Pyrrolo[2,3-b]pyridine-5-carboxamide, 4-[(5-hydroxytricyclo[3.3.1.1^{3,7}]dec-2-yl)amino]-, stereoisomer

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO 65 mg/mL (199.14 mM);Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%,BR

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Peficitinib (ASP015K, JNJ-54781532)是一种具有生物活性的 JAK 抑制剂。Phase 3。			
靶点	JAK3	JAK1	Tyk2	JAK2
	0.7 nM (IC ₅₀)	3.9 nM (IC ₅₀)	4.8 nM (IC ₅₀)	5 nM (IC ₅₀)
体外研究	ASP015K 抑制 IL-2-诱导的人 T 细胞增殖，比 EPO-诱导的人红白血病细胞的增殖具有更高的效能。在人全血中，ASP015K 抑制 STAT5 磷酸化(pSTAT5)。			
体内研究	在大鼠 AIA 模型中，ASP015K (p.o.)显著减少足肿胀和踝关节骨质破坏概率。			

美仑相关产品推荐

CL-10238	ZM 39923 HCl
MB2615	Upadacitinib(ABT-494)；乌帕替尼
MB3926	Baricitinib (LY3009104, INCB028050)
MB3928	Momelotinib (CYT387)
MB5455	Ruxolitinib(INCB018424) phosphate

MB3932	S-Ruxolitinib (INCB018424)
--------	----------------------------

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。Peficitinib (ASP015K, JNJ-54781532)是一种具有生物活性的 JAK 抑制剂，用于治疗一些自身免疫性疾病及相关领域的研究。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.0638 mL	15.3191 mL	30.6382 mL
5 mM	0.6128 mL	3.0638 mL	6.1276 mL
10 mM	0.3064 mL	1.5319 mL	3.0638 mL
50 mM	0.0613 mL	0.3064 mL	0.6128 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	使用链霉抗生物素蛋白包被的 96 孔板进行 JAK1, JAK2, JAK3, TYK2-结构域测定。反应混合物含有 15mM Tris-HCl (pH 7.5), 0.01%吐温 20, 2mM 二硫苏糖醇, 10mM MgCl ₂ , 250nM 生物素-Lyn-底物-2 (对于 JAK1,2 和 3) 或生物素-IRS1-底物 (对于 TYK2) 和 ATP (终浓度为 200μM[JAK1], 10μM[JAK2], 8μM[JAK3]和 4μM[TYK2])。将培立替尼或托法替尼溶解于 DMSO 中。通过添加激酶结构域引发反应, 然后在室温下孵育 1 小时。使用磷酸酪氨酸特异性 ELISA, 使用 HRP-缀合的抗磷酸酪氨酸抗体 (HRP-PY-20) 测量激酶活性, 作为生物素-Lyn-底物-2 或生物素-IRS-底物的磷酸化速率。Peficitinib 的 TYK2 激酶测定在 ATP 浓度为 10μM 时进行。
细胞实验	将来自雄性 Lewis 大鼠的脾细胞悬浮于补充有 10%胎牛血清和 50μM2-巯基乙醇的 RPMI1640 中, 密度为 1.5×10 ⁶ 个细胞/mL。将大鼠脾细胞与伴刀豆球蛋白 A 在 37°C下培养 24 小时以诱导 IL-2 受体表达。然后将脾细胞与指定浓度的 IL-2 和培立替尼或托法替尼在 96 孔组织培养板中孵育。孵育 3 天后, 将 alamarBlue®加入每个测试孔中, 然后孵育 4-6 小时。在 545nm 的激发波长和 590nm 的发射波长下测量荧光强度。所有实验一式三份进行, 并且实验分别进行四次或一次用于使用 Peficitinib 或 tofacitinib 的测定。对于每个个体, 为细胞制备用细胞和培养基单独培养的孔, 并且为对照制备不含 JAK 抑制剂的 IL-2 刺激细胞。为了计算 JAK 抑制剂的抑制百分比, 空白和对照分别被指定为 100%和 0%抑制。
动物实验	Peficitinib 溶于 0.5%甲基纤维素。 大鼠 将 7 周龄雌性 Lewis 大鼠用于佐剂诱导的关节炎 (AIA) 模型。测量每只大鼠的体重和左后爪体积 (MK-101PR 体积计), 并且该值用于将动物分配到六组中的一组 (n = 10)。通过将液体石蜡中的结核分枝杆菌 H37RA 菌株 (0.5mg /大鼠) 悬浮液注入右后足垫, 在第 0 天在这些组中的 5 个中诱导关节炎。其余组未注射佐剂 (正常组, n = 10)。对于口服给药方案, 注射佐剂的组中的四个每天一次接受溶解在 0.5%甲基纤维素 (MC) 中的 Peficitinib (1,3,10 和 30mg / kg)。正常组和对照组的大鼠仅接受 0.5%的 MC。

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。