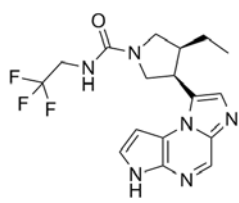


Upadacitinib(ABT-494) ; 乌帕替尼

产品编号 : MB2615
 质量标准 : >98%,BR
 包装规格 : 1MG ; 5MG
 产品形式 : 白色至黄色固体

基本信息

分子式	C17H19F3N6O	结 构 式	
分子量	380.37		
CAS No.	1310726-60-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: ≥ 22 mg/mL Water : 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: 乌帕替尼 Upadacitinib (ABT-494) 是一种高效, 有选择性的 JAK1 抑制剂, 用于治疗一些自身免疫性疾病, IC50 值为 43 nM。

别名: ABT-494 ; 乌帕替尼 ; 1-Pyrrolidinecarboxamide, 3-ethyl-4-(3H-imidazo[1,2-a]pyrrolo[2,3-e]pyrazin-8-yl)-N-(2,2,2-trifluoroethyl)-, (3S,4R)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至黄色固体
 溶解性 :DMSO: ≥ 22 mg/mL ; Water : Insoluble
 含量 :>98%,BR

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展

风湿性关节炎(RA)是一种以滑膜炎和关节破坏为特征的全身自身免疫性疾病。在治疗风湿性关节炎方面取得了相当大的进展。这些生物制剂需要静脉注射或皮下注射, 一些患者对生物 DMARDs 没有反应或失去了最初的反应。各种细胞因子和细胞表面分子与细胞表面的受体结合, 导致各种细胞信号通路的激活, 包括激酶蛋白的磷酸化。在这些激酶中, 非受体酪氨酸激酶家族 Janus 激酶(JAK)在 RA 的病理过程中起着关键作用。几种 JAK 抑制剂已被开发为治疗风湿性关节炎的新疗法。这些是口服合成的 DMARDs 抑制 JAK1, 2 和 3。JAK 抑制剂 tofacitinib 已经在许多国家得到批准。目前正在使用 filgotinib 和 **ABT-494**, 特异性 JAK1 抑制剂的临床三期试验。JAK 抑制剂是 RA 的新疗法, 但需要进一步的研究来确定它们的风险-收益比和选择最合适的患者进行这种治疗。

产品描述	乌帕替尼 Upadacitinib (ABT-494) 是一种高效, 有选择性的 JAK1 抑制剂, 用于治疗一些自身免疫性疾病, IC50 值为 43 nM。
靶点	IC50: 43 nM (JAK1), 200 nM (JAK2)
体外研究	在生化检测中, 阿伐他替尼对 JAK-1 的选择性比 JAK-2 (其参与红细胞生成) 高 74 倍, JAK-1 的选择性比 JAK-3 的 58 倍 (这涉及免疫监视)。UAADACITIB 对 JAK-1 在 JAK-2 和 JAK-3 上的选

	择性增强可能在 RA 范围内提供改善的风险-风险分布。
体内研究	AbbVie 开发的第二种 JAK 抑制剂 Upadacitinib 被描述为第二代抑制剂。多剂量 I 期研究于 2013 年完成。在 I 期试验中,使用立即释放制剂,发现 Upadacitinib 安全且耐受良好,直至多剂量 24 mg,每日两次。Upadacitinib 暴露在评估的多剂量中与剂量成比例。

美仑相关产品推荐

CL-10238	ZM 39923 HCl
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。乌帕替尼 Upadacitinib (ABT-494) 是一种高效,有选择性的 JAK1 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 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6290 mL	13.1451 mL	26.2902 mL
5 mM	0.5258 mL	2.6290 mL	5.2580 mL
10 mM	0.2629 mL	1.3145 mL	2.6290 mL

【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。