

Baricitinib ; LY3009104 ; INCB028050

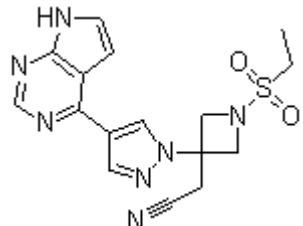
产品编号 : MB3926

质量标准 : >98% , JAK1 和 JAK2 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C16H17N7O2S	结 构 式	
分子量	371.42		
CAS No.	1187594-09-7		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 74 mg/mL (199.23 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 : 巴瑞克替尼 Baricitinib 是选择性, 可口服的 JAK1 和 JAK2 抑制剂。

别名 : INCB028050; LY3009104 ; 3-Azetidineacetonitrile; 巴瑞克替尼; Baricitinib;

1-(ethylsulfonyl)-3-[4-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pyrazol-1-yl]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至灰色固体

溶解性 :DMSO : 74 mg/mL (199.23 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 :>98%

储存条件 : -20°C , 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Baricitinib (LY3009104, INCB028050)是一种选择性 JAK1 和 JAK2 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 分别为 5.9 nM 和 5.7 nM, 比作用于 JAK3 和 Tyk2 选择性高 70 和 10 倍左右, 对 c-Met 和 Chk2 没有抑制作用。			
靶点	JAK2 (Cell-free assay)	JAK1 (Cell-free assay)	TYK2 (Cell-free assay)	JAK3 (Cell-free assay)

	5.7 nM	5.9 nM	53 nM	>400 nM
体外研究	在外周血单核细胞中 Baricitinib 抑制 IL-6 刺激的典型底物 STAT3 (pSTAT3) 的磷酸化以及随后趋化因子 MCP-1 的产生, IC50 值分别为 44 nM 和 40 nM。在独立的幼稚型 T 细胞中 Baricitinib 也可以抑制 IL-23 刺激的 STAT3 的磷酸化, IC50 为 20 nM。			
体内研究	<p>Baricitinib 在全血中抑制 IL-6 刺激的 STAT3 磷酸化, IC50 为 128 nM。Baricitinib (10 mg/kg 口服)预期能够在大鼠中抑制 JAK1/2 信号 (抑制率≥50%)达 8 小时。Baricitinib (10mg/mL,口服)可以抑制佐剂性关节炎大鼠模型的疾病得分并且具有剂量依赖特性。与对照组相比, 1mg/kg Baricitinib 处理两周可以对雌鹿爪子体积增长抑制 50%, 3 mg/kg 或 10 mg/kg 剂量可以抑制 95%以上。与对照组相比, 1mg/kg Baricitinib 处理可以对佐剂性关节炎大鼠模型免疫浸润, 水肿, 和关节周围组织外观的综合得分抑制 27%, 3mg/kg 可以抑制 64%, 10 mg/kg 可以抑制 82%。1, 3 和 10 mg/kg Baricitinib 分别使佐剂性关节炎大鼠模型骨吸收减少 15%, 61%和 67%。Baricitinib (10mg/kg,每天一次连续 2 周, 口服)可以使佐剂性关节炎大鼠模型踝关节和跗骨的正常结构和外观得到影像学上的改善。Baricitinib 可以降低达拉亚动物外周血中 STAT3 的磷酸化水平, 并且具有剂量和时间依赖的特性。Baricitinib (10 mg/mL, 口服)可以使小鼠胶原蛋白诱导的关节炎 (CIA) 模型的关节损伤综合得分提高 47%。在胶原抗体诱导的关节炎(CAIA)小鼠模型中 Baricitinib (10 mg/kg) 可以减少血管翳 (74%)和骨损伤(78%), 改善软骨损伤 (43%)和炎症信号 (33%), 使疾病综合得分提高 53%。在 CIA 和 CAIA 模型中, Baricitinib (10 mg/kg)可以对迟发型超敏反应抑制 48%[1]。Baricitinib 对于活动性类风湿关节炎病人是有效的, 而疾病修饰药物和生物制剂大多很难有效。Baricitinib 优先抑制 JAK1 和 JAK2, 选择性高于 Tyk2 10 倍, 高于 JAK3 100 倍。观察到的 GLPG-0634 对于 ACR20 的效果至少和 tofacitinib 一样而且优于 Baricitinib, 因为 Baricitinib 仅在一项二期临床实验中可以适度地影响 ACR20 值。Baricitinib 具有剂量限制的副作用, 会诱发贫血病, 这是由于对 JAK2 的影响造成的, 但是无论如何它的药效非常明确。</p>			

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3925	WP1066
MB4568	BMS-911543
MB3929	CEP-33779
MB3923	Fedratinib (SAR302503, TG101348)

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。巴瑞克替尼 Baricitinib 是选择性, 可口服的 JAK1 和 JAK2 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.6924 mL	13.4618 mL	26.9237 mL

5 mM	0.5385 mL	2.6924 mL	5.3847 mL
10 mM	0.2692 mL	1.3462 mL	2.6924 mL
50 mM	0.0538 mL	0.2692 mL	0.5385 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验:	<p>Animal Models: 胶原蛋白诱导的关节炎(CIA)小鼠模型</p> <p>Formulation: 0.5%甲基纤维素</p> <p>Dosages: 10 mg/mL</p> <p>Administration: 口服</p>
--------------	--

【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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。