

Momelotinib ; CYT387

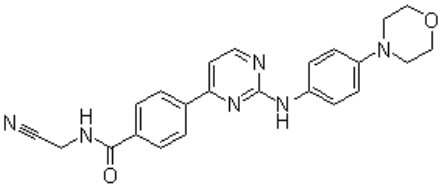
产品编号 : MB3928

质量标准 : >98% , JAK1/JAK2 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C23H22N6O2	结 构 式	
分子量	414.46		
CAS No.	1056634-68-4		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 74 mg/mL (178.54 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 : CYT387 是 ATP 竞争性的 JAK1/JAK2 抑制剂。**别名 :** CYT387 ; Benzamide, N-(cyanomethyl)-4-[2-[[4-(4-morpholinyl)phenyl]amino]-4-pyrimidinyl]-**物理性状及指标 :**

外观 :淡黄色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 74 mg/mL (178.54 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	CYT387 是 ATP 竞争性 JAK1/JAK2 抑制剂, IC50 为 11 nM/18 nM,比作用于 JAK3 选择性高 10 倍左右。		
靶点	JAK1	JAK2	JAK3
IC50	11 nM	18 nM	155 nM
体外研究	CYT387 有效且选择性作用于 JAK1 和 JAK2, IC50 分别为 11 nM 和 18 nM, 效果比作用于		

	密切相关的 JAK3 激酶(IC50 为 155 nM)高 9 倍。在体外, CYT387 抑制 IL-3 刺激的亲本 Ba/F3 细胞(Ba/F3-wt) 增殖, IC50 为 1400 nM。而且, CYT387 作用于组成型激活的 JAK2 或 MPL 信号的细胞系,包括 Ba/F3-MPLW515L 细胞, CHRF-288-11 细胞, 和 Ba/F3-TEL-JAK2 细胞, 也抑制细胞增殖, IC50 分别为 200 nM, 1 nM 和 700 nM。此外,CYT387 在体外抑制 JAK2V617F 阳性 PV 患者的红系集落生长具有相似效果, IC50 为 2 μ -4 μ M。最新研究显示 CYT387 抑制 IL-6 和 IGF-1 诱导的 PI3K/AKT 和 Ras/MAPK 信号。而且, CYT387 单独用药, 以及和传统抗 MM 治疗药 Bortezomib 和 Melphalan 联用于原发性多发骨髓瘤(MM)细胞, 诱发细胞凋亡。
体内研究	CYT387 作用于鼠 MPN 模型, 使白细胞数, 血球密度, 脾脏大小正常化,且恢复炎性细胞因子生理水平。
特征	CYT387 是 ATP 竞争性小分子 JAK1 和 JAK2 抑制剂。

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)

MB3926	Baricitinib (LY3009104, INCB028050)
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。CYT387 是 ATP 竞争性的 JAK1/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		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4128 mL	12.0639 mL	24.1278 mL
5 mM	0.4826 mL	2.4128 mL	4.8256 mL
10 mM	0.2413 mL	1.2064 mL	2.4128 mL
50 mM	0.0483 mL	0.2413 mL	0.4826 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	无细胞激酶活性检测实验测定 IC50 值: 在肽底物磷酸化实验之前, 纯化在昆虫细胞中表达的谷胱甘肽-S-转移酶 (GST) 标记的 JAK 激酶域。在 384 孔板上, 使用 Alphascreen 蛋白酪氨酸激酶 P100 检测试剂盒和
------	--

	PerkinElmer Fusion Alpha 仪器进行检测实验。
细胞实验	<p>Cell lines: Ba/F3, Ba/F3-JAK2V617F 和 Ba/F3-MPLW515L</p> <p>Concentrations: 0 到 10 μM</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 使用表达 JAK2V617F (Ba/F3-JAK2V617F) 和 MPLW515L (Ba/F3-MPLW515L) 突变型的 Ba/F3 细胞, 以及 CHRF-288-11(JAK2T875N)和 CMK(JAK3A572V)细胞。获得 TEL/JAK2 和 TEL/JAK3 融合, 然后引进 Ba/F3 鼠科细胞中。TEL/JAK2- 或 TEL/JAK3-转染的细胞培养在含 10%胎牛血清(FCS)的 DMEM 培养基上。Ba/F3 野生型细胞培养在含 10% FCS 及 5 ng/mL 鼠 IL-3 的 RPMI 培养基上。在 37°C 下 5% CO₂ 环境中温育 72 小时, 然后通过 Alamar Blue 检测实验测定增殖。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 移植了转导 JAK2V617F 逆转录病毒的骨髓的 Balb/c 小鼠</p> <p>Formulation: Cyt387 溶于 NMP (120 mg/mL)。随后使用 0.14 M Captisol 稀释 CYT387/NMP 混合物, 使其浓度变为 6 mg/mL, 再使用 0.1M Captisol 稀释, 使其浓度变为 4 mg/mL。</p> <p>Dosages: \leq50 mg/kg</p> <p>Administration: 口服处理</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。