

CEP33779

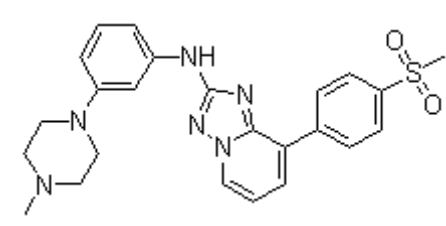
产品编号：MB3929

质量标准：>98%，选择性 JAK2 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C ₂₄ H ₂₆ N ₆ O ₂ S	结 构 式	
分子量	462.57		
CAS No.	1257704-57-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 36 mg/mL (77.82 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：CEP-33779 是一个新颖的，选择性，有口服活性的 JAK2 抑制剂。

别名：[1,2,4]Triazolo[1,5-a]pyridin-2-amine, N-[3-(4-methyl-1-piperazinyl)phenyl]-8-[4-(methylsulfonyl)phenyl]-

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 36 mg/mL (77.82 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	CEP-33779 是一种选择性 JAK2 抑制剂，IC ₅₀ 为 1.8 nM，比作用于 JAK1 和 TYK2 选择性高 40 多倍和 800 多倍。		
靶点	<table border="1"> <tr> <td>JAK2 (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>1.8 nM</td> </tr> </table>	JAK2 (Cell-free assay)	1.8 nM
JAK2 (Cell-free assay)			
1.8 nM			

体外研究	在 HEL92 细胞中，CEP33779(<3 μM)浓度依赖性抑制下游靶点信号转换器的磷酸化和 JAK2 的 5(pSTAT5)转录激活。
体内研究	来自 HEL92 异种移植小鼠体内的 HEL9 肿瘤提取物中，CEP33779 以 55 mg/kg 的剂量口服给药抑制 STAT5 磷酸化。在胶原-抗体诱导性关节炎(CAIA)或胶原诱导性关节炎(CIA)小鼠体内，CEP33779 以 55 mg/kg 的剂量，每天两次口服给药减少平均足肿胀和临床症状。CEP33779 以 55 mg/kg 的剂量每天两次口服给药完全抑制 CAIA 或 CIA 小鼠爪子磷酸-STAT3 表达，与细胞因子，包括 IL-12，IFN γ ，IL-2，IL-1 β ，TNF α 和 GM-CSF 的减少相关。CAIA 或 CIA 小鼠体内，CEP33779 剂量依赖性减少骨退化，组织破坏和骨关节炎。在 MRL/lpr 全身性红斑狼疮小鼠体内，CEP33779 以 100 mg/kg 口服给药延长生存期，并减少脾肿大/淋巴结肿大，从而保护小鼠避免发展为肾小球性肾炎。在 MRL/lpr 全身性红斑狼疮小鼠体内，CEP33779 以 100 mg/kg 口服给药减少几个 SLE 相关的促炎性细胞因子，并降低与破骨细胞活性增加相关的骨吸收生物标志物的水平。在结肠炎诱导的结直肠炎小鼠模型中，CEP33779 以 55 mg/kg 的剂量每天两次口服给药，诱导已建立的结直肠肿瘤退化，减少血管生成，并减少肿瘤细胞的增殖。肿瘤退化与 STAT3 和 NF- κ B (RelA/p65)活化的抑制，促炎性细胞因子表达的减少，以及促进肿瘤的细胞因子白介素(IL)-6 和 IL-1 β 的减少相关。

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)

MB3924	AZD1480
MB3926	Baricitinib (LY3009104, INCB028050)
MB4568	BMS-911543

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。CEP-33779 是一个新颖的，选择性，有口服活性的 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	2.1618 mL	10.8092 mL	21.6183 mL
5 mM	0.4324 mL	2.1618 mL	4.3237 mL
10 mM	0.2162 mL	1.0809 mL	2.1618 mL
50 mM	0.0432 mL	0.2162 mL	0.4324 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验：	Animal Models: 胶原诱导性关节炎(CIA)和胶原-抗体诱导性关节炎(CAIA)小鼠 Formulation: 二甲基亚砜(DMSO) (1% 终浓度) Dosages: 55 mg/kg
--------------	---

Administration: 每天两次，口服给药

【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。