S-Ruxolitinib；INCB018424

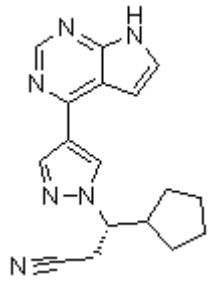
产品编号：MB3932

质量标准：>98%，选择性 JAK1/2 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C17H18N6	结构式	
分子量	306.37		
CAS No.	941685-37-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：61 mg/mL (199.1 mM)		
	Water：5 mg/mL (16.32 mM)		
	Ethanol：61 mg/mL (199.1 mM)		
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：鲁索利替尼 (S 型对映体) Ruxolitinib(INCB018424) S 型对映体。 Ruxolitinib(INCB018424)是第一个进入临床的高活性 JAK1 和 2 选择性抑制剂。

别名：S-Ruxolitinib; INCB18424；鲁索利替尼 (S 型对映体)；1H-Pyrazole-1-propanenitrile, β-cyclopentyl-4-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-, (βS)-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：61 mg/mL (199.1 mM);Water：5 mg/mL (16.32 mM);Ethanol：61 mg/mL (199.1 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	S-Ruxolitinib (INCB018424)是第一个应用到临床的，有效的，选择性 JAK1/2 抑制剂，IC50 为 3.3 nM/2.8 nM，作用于 JAK1/2 比作用于 JAK3 选择性高 130 倍以上。
靶点	JAK2 JAK1 TYK2

	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)
	2.8 nM	3.3 nM	19 nM

体外研究	INCB018424 作用于 Ba/F3 细胞和 HEL 细胞，有效且选择性抑制 JAK2V617F 介导的信号和增殖。INCB018424 作用于 Ba/F3 细胞，显著增强凋亡，这种作用具有剂量依赖性。INCB018424(64 nM) 作用于 Ba/F3 细胞，导致细胞线粒体去极化增加一倍。INCB018424 抑制正常供体和真性红细胞增多症患者提供的红系祖细胞增殖，IC50 分别为 407 nM 和 223 nM。INCB018424 显著有效作用于红系细胞集落形成，IC50 为 67nM。
体内研究	INCB018424 按 180 mg/kg 剂量口服处理 JAK2V617F 驱动的小鼠模型,每天两次 ，到第 22 天，存活率大于 90%。INCB018424 按 180 mg/kg 剂量口服处理 JAK2V617F 驱动的小鼠模型,每天两次，显著降低脾肿大及炎性细胞因子的循环水平，并优先消灭肿瘤细胞，显著延长生存期，且没有骨髓抑制或免疫抑制作用。Ruxolitinib 维持脾体积降低，且使总症状得分提高 50%或更多。Ruxolitinib 按 15 mg 处理骨髓纤维化患者，每天两次，在 48 周时，共 28%患者的脾脏体积至少减少 35%，而接受最好治疗的组则为 0%。Ruxolitinib 处理，48 周，平均脾脏长度下降了 56%，而最好治疗组增加了 4%。Ruxolitinib 处理的患者组整体生活质量得到改进，与骨髓纤维化有关的症状减少。

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)

MB5455	Ruxolitinib(INCB018424) phosphate
MB3930	Gandotinib (LY2784544)
MB3928	Momelotinib (CYT387)

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。Ruxolitinib(INCB018424)是第一个进入临床的高活性 JAK1 和 2 选择性抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体积 / 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.2640 mL	16.3201 mL	32.6403 mL
5 mM	0.6528 mL	3.2640 mL	6.5281 mL
10 mM	0.3264 mL	1.6320 mL	3.2640 mL
50 mM	0.0653 mL	0.3264 mL	0.6528 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	结合实验: 使用 Sf21 细胞和杆状病毒载体表达重组蛋白，并通过亲和层析来纯化。通过均相时间分辨荧光测定法，使用肽底物（-EQEDEPEGDYFEWLE）进行 JAK 激酶测定。使用 Ruxolitinib 或对照，JAK 酶，500nM 肽，三磷酸腺苷（ATP; 1mM），和 2%DMSO 进行各组酶反应 1 小时。计算 50%抑制浓度（IC50），即抑制 50%荧光信号所需要的 INCB018424 浓度。
细胞实验	**Cell lines:** Ba/F3 和 HEL 细胞 **Concentrations:** 3 μM **Incubation Time:** 48 小时 **Method:** 细胞按每孔 2×103 个接种在白底 96 孔板中，使用溶于 DMSO 储存液 (DMSO 终浓度为 0.2%)的 INCB018424 处理,在 37°C 下含 5% CO2 的环境中温育 48 小时。通过细胞 ATP 测定法，使用 Cell-Titer Glo 荧光素酶试剂测量生存力或活细胞计数。值转化为相对于对照组的抑制百分数，根据对数值的非线性回归分析，使用 PRISM GraphPad，拟合 IC50 曲线。
动物实验	**Animal Models:** JAK2V617F 驱动的小鼠模型 **Formulation:** 5%二甲基乙酰胺，0.5%甲基纤维素 **Dosages:** 180 mg/kg **Administration:** 口服饲喂

【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。