

## GLPG0634 analogue ; GLPG0634

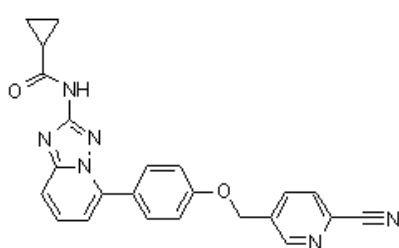
产品编号 : MB4107

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C23H18N6O2	结 构 式	
分子量	410.43		
CAS No.	1206101-20-3		
储存条件	常温, 充氮, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 0.1 mg/mL (0.24 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 :** GLPG0634 (类似物) 是一种泛 JAK 抑制剂。

**别名 :** Cyclopropanecarboxamide, N-[5-[4-[(6-cyano-3-pyridinyl)methoxy]phenyl][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyridin-2-yl]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....淡黄色至卡其色固体

溶解性 : .....DMSO : 0.1 mg/mL (0.24 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

含量 : .....>98%

**储存条件 :** 常温, 充氮, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	GLPG0634 analogue 是选择性的 JAK1 抑制剂, 其作用于 JAK1, JAK2, JAK3, 和 TYK2 的 IC50 分别为 10 nM, 28 nM, 810 nM, 和 116 nM。Phase 2。
<b>靶点</b>	JAK
<b>体外研究</b>	在细胞系中, GLPG0634 抑制 IL-2 和 IL-4 诱导的 JAK1/JAK3/γc 信号和 IFN-α2 诱导的 JAK1/TYK2 II 型受体信号, IC50 的范围为 150 到 760 nM。在细胞水平上, GLPG0634 对

	包含 JAK1 的 JAK/STAT 信号比 JAK2 激酶具有更高的选择性。此外，GLPG0634 也会抑制 Th1, Th2, 和 Th17 细胞的增殖。
<b>体内研究</b>	口服给药后，绝对生物利用度在大鼠(45%)体内适中，而在小鼠(~100%)体内较高。在大鼠和小鼠的 CIA 模型中，GLPG0634 (30 毫克/千克，每天(大鼠)；50 毫克/千克，每天两次(小鼠))剂量依赖性减少炎症，软骨，以及骨降解。

**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)**

MB3982	WHI-P154
MB3925	WP1066
MB4581	XL019

**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。GLPG0634 (类似物) 是一种泛 JAK 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 大鼠 CIA 模型和小鼠 CIA 模型</p> <p><b>Formulation:</b> 0.5% (v/v) 甲基纤维素</p> <p><b>Dosages:</b> 30 毫克/千克，每天(大鼠)；50 毫克/千克，每天两次(小鼠)</p> <p><b>Administration:</b> 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。