

Tofacitinib (CP-690550, Tasocitinib) ; 托法替尼 ; CP-690550

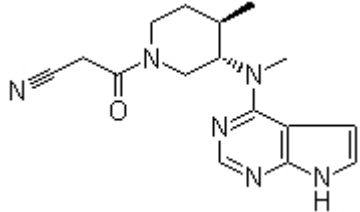
产品编号 : MB4155

质量标准 : >98% , JAK3 抑制剂

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C16H20N6O	结 构 式	
分子量	312.37		
CAS No.	477600-75-2		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 62 mg/mL warmed (198.48 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 : 托法替尼 Tofacitinib 是 JAK1/2/3 抑制剂。

别名 : Tasocitinib; CP-690550 ; 1-Piperidinepropanenitrile,

4-methyl-3-(methyl-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-.beta.-oxo-, (3R,4R)-

物理性状及指标 :

外观 :类白色至淡黄色固体

溶解性 :DMSO : 62 mg/mL warmed (198.48 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	Tofacitinib 是新型 JAK3 抑制剂, IC50 为 1 nM, 作用于 JAK2 和 JAK1 选择性低 20 到 100 倍。		
靶点	JAK3(Cell-free assay)	JAK1(Cell-free assay)	JAK2(Cell-free assay)
IC50	1 nM	112 nM	20 nM
体外研究	CP-690550 是特定的口服 JAK3 抑制剂, 作用于 JAK2 和 JAK1, 效果分别低 20 和 100 倍。CP-690550 对 30 种其他激酶没有作用效果, 平均 IC50 > 3000 nM。CP-690,550 抑制 IL-2 诱导的增殖, 比作用于 GM-CSF 诱导的增殖效果强 30 倍。CP-690550 高效抑制小鼠混合淋巴反应 (MLR)(IC50 = 91 nM)。CP-690550 作用于小鼠 B 细胞, 有效抑制 IL-4 诱导的 CD23 (IC50=57 nM) 和 II 类主要组织相容性复合体(MHCII) 表达上调, IC50=71 nM。最新研究显示, 通过加强 Th17 分化, 低剂量 CP-690550 加速实验性自身免疫脑脊髓炎的发生。		
体内研究	CP-690550 作用于异位心脏移植(DBA2 供体心脏移到 C57/BL6 宿主)的小鼠模型, 提高移植后心		

脏的寿命 这种作用存在剂量依赖性。EC50(50%小鼠将保持移植 >28 天时血液中药物浓度) 为~60 ng/mL。CP-690550 作用于非人灵长类动物 (NHPs, 食蟹猴) (50 到 100 ng/ml 剂量实验组和 200 到 400 ng/ml 剂量实验组的 MST 分别为 62 和 83 天), 防止同种异体肾移植的排斥反应。CP-690550 每天按 1.5-15 mg/kg 剂量长期作用于小鼠, 通过流式细胞仪检测, 发现淋巴细胞亚群发生改变, 这种作用存在剂量和时间依赖性。处理 21 天, 观察到最显著的变化是脾 NK1.1+TCRb 细胞数降低 96%。CP-690550 按 1.87-30 mg/kg 剂量皮下注射给药敏感小鼠, 延迟型过敏反应降低, 这种作用存在剂量依赖性。

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)

MB3358	Tofacitinib (CP-690550) Citrate
MB3982	WHI-P154

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。托法替尼 Tofacitinib 是 JAK1/2/3 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.2013 mL	16.0067 mL	32.0133 mL
5 mM	0.6403 mL	3.2013 mL	6.4027 mL
10 mM	0.3201 mL	1.6007 mL	3.2013 mL
50 mM	0.0640 mL	0.3201 mL	0.6403 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>JAK3 激酶实验:</p> <p>全长 cDNA 中编码人 JAK3 催化结构域(785aa 到 1125aa, JH1 催化结构域)的片段通过 PCR 放大, 且克隆到杆状病毒转移载体 pVL1393 的 EcoRI 位点。使用重组杆状病毒感染 Sf9 细胞, 在谷胱甘肽琼脂糖凝胶上分离重组 GSTJAK3 融合蛋白。使用还原型谷胱甘肽洗脱融合蛋白 然后储存在含 50 mM Tris, pH 7.5, 10 mM DTT 和 10% 甘油的缓冲液中。通过 ELISA 按如下测量 JAK3 激酶活性: 使用随机 L-谷氨酸和酪氨酸共聚物 (4:1) (100 ug/mL)包被实验板过夜。冲洗实验板, 在有或无抑制剂时, 重组 JAK3 JH1:GST(每孔 100 ng)在室温下温育 30 分钟, 然后加入 HRP 结合的 PY20 抗磷酸酪氨酸抗体(ICN), 然后通过 TMB(3,3',5,5'-四甲基联苯胺)电泳。使用 ELISA 法测定酪氨酸激酶催化活性, 而通过放射性酶实验测定丝/苏氨酸激酶。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: 人类 T 细胞</p> <p>Concentrations: 0-4000 nM</p> <p>Incubation Time: 4 天</p> <p>Method: 为了测量 IL-2 依赖的增殖, 分离的淋巴细胞按 $1-2 \times 10^6$/mL 密度再悬浮在完全 RPMI 培养基(RPMI 1640 含 10% (w/v)胎牛血清(FCS), 1%(w/v) 青霉素和链霉素)中。加入植物血细胞凝集素(PHA), 终浓度为 10mg/mL, 培养物在 37°C 下含 5% (v/v) CO₂ 湿润孵育器中温育 3 天, 用于上调 IL-2R 和 JAK3 表达。在有或无 CP-690,550 时, 加入 IL-2 (200U/mL), 细胞在 37°C 下含 5% (v/v) CO₂ 湿润孵育器中温育, 72 小时后加入 50 mL ³H-胸苷(5mCi/mL)。实验板再温育 18 小时, 使用 96 孔收集器收集, 然后在闪烁计数器中计数。HUO3 细胞培养在含粒</p>

	细胞-巨噬细胞集落刺激因子的培养基中，人包皮成纤维细胞培养在含 10% 胎牛血清的培养基中。在新鲜培养的细胞中加入 CP-690550，培养 4 天。在培养期的最后 18 小时，加入 ³ H 胸苷。
动物实验	<p>Animal Models: DBA/2 和 C57/BL6 小鼠</p> <p>Formulation: CP-690550 溶于 PEG300</p> <p>Dosages: 0-136 ng/mL</p> <p>Administration: 渗透微泵输入</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，请选择用合适溶剂 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。给药剂量的时候，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。