

AZ960 ; AZ 960

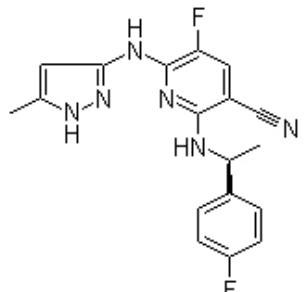
产品编号 : MB4580

质量标准 : >98% , AK2 抑制剂

包装规格 : 2MG;5MG;10MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C18H16F2N6	结 构 式	
分子量	354.36		
CAS No.	905586-69-8		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO：71 mg/mL (200.36 mM)		
	Water：Insoluble		
	Ethanol：3 mg/mL (8.46 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 : AZ960 是高效选择性的 JAK2 激酶抑制剂。

别名 : 3-Pyridinecarbonitrile,

5-fluoro-2-[[[(1S)-1-(4-fluorophenyl)ethyl]amino]-6-[(5-methyl-1H-pyrazol-3-yl)amino]-

物理性状及指标 :

外观 :淡黄色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 71 mg/mL (200.36 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 3 mg/mL (8.46 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	AZ 960 是一种新型的，ATP 竞争性的 JAK2 抑制剂，IC ₅₀ 和 K _i 分别低于 3 nM 和 0.45 nM，作用于 JAK2 比作用于 JAK3 选择性高 3 倍。
靶点	JAK2 JAK2 0.45 nM(Ki) <3 nM
体外研究	AZ 960 抑制 JAK2 酶活性，K_i 为 0.45 nM，IC₅₀ < 3 nM。此外，0.1 μM AZ960 也抑制 83 种激酶中的 31 种，如 JAK3(IC₅₀ 为 9 nM)，TrkA, Aurora, 和 ARK5。AZ 960 作用于 TEL-JAK2 细胞，抑制 STAT5 磷酸化，平均 IC₅₀ 为 15 nM，作用于 TEL-JAK2 驱动的 STAT5 磷酸化比作用于其他 JAK 激酶家族成员(TEL-JAK1, -JAK3, 和 -TYK2)驱动细胞系选择性高 15 到 30 倍。AZ 960 有效抑制 TEL-JAK2, -JAK1, -JAK3, 和 -Tyk2 细胞增殖，GI₅₀ 分别为 25 nM, 230 nM, 279 nM, 和 214 nM。而且，通过降低 STAT3 和 STAT5 磷酸化水平，AZ 960 也有效抑制 SET-2 细胞增殖，平均 GI₅₀ 为 33 nM。AZ 960 引起人类 T-细胞淋巴瘤细胞病毒 1 型 (HTLV-1) 感染的 T 细胞 (MT-1 和 MT-2) 生长停滞和凋亡，且通过小干扰 RNA 增强 AZ 960 作用于 MT-1 细胞的抗增殖效果，而抑制 Bcl-xL。最新研究显示 AZ 960 显著抑制患者新分离的 AML 细胞克隆性生长，和诱导细胞凋亡。

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)

MB3927	<u>AT9283</u>
MB3924	<u>AZD1480</u>
MB3926	<u>Baricitinib (LY3009104, INCB028050)</u>

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。AZ960 是高效选择性的 JAK2 激酶抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 浓 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.8220 mL	14.1099 mL	28.2199 mL
5 mM	0.5644 mL	2.8220 mL	5.6440 mL
10 mM	0.2822 mL	1.4110 mL	2.8220 mL

50 mM	0.0564 mL	0.2822 mL	0.5644 mL
-------	-----------	-----------	-----------

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	酶的生化检测及激酶剖析: 使用重组 JAK2 激酶 (第 808–1132 位氨基酸)在肽(Tyk2 肽)浓度为 100 nM 和 ATP 浓度为 15 μM 时,进行 AZ 960 抑制研究。使用的 AZ 960 浓度为 0.003 μM 到 30 μM。通过抑制动力学研究进一步评估 AZ960 作用于 JAK2 激酶的抑制模式和抑制常数 (K_i)。在含混合浓度肽 (FL-Ahx-IPTSPITTTYFFKKK-COOH), 及不同浓度 ATP 和 AZ 960 的 HEPES buffer(75 mM, pH 7.3)中进行一系列 JAK2 催化反应。通过 Caliper LC3000 系统监测每组反应进程,然后从相应反应时间过程中抽提初始反应速度。为了定义抑制模式,使用 Lineweaver-Burk 曲线,绘制初始速度对相应 ATP 浓度的曲线,则 y 轴上的收敛特征说明 AZ 960 对 ATP 的竞争能力。使用米氏方程,计算 K_i,显示 AZ960 是结合紧密的 JAK2 抑制剂。AZ960 按三种抑制浓度(0.01 μM, 0.10 μM, 和 1.0 μM)作用于 83 种激酶。
细胞实验	Cell lines: SET-2 和 TEL-JAK Ba/F3 Concentrations: 0.016 到 10 μM Incubation Time: 48-72 小时 Method: 使用荧光/比色 BIOSOURCE AlamarBlue 检测分析细胞增殖,然后在 Spectra Max Gemini EM 酶标仪上读数。SET-2 细胞按每孔 20,000 个细胞, TEL-JAK2 Ba/F3 细胞按每孔 2000 个细胞,所有其他 TEL-JAKs 按每孔 5000 个细胞接种在 96 孔板上。接种后,使用 AZ 960 处理细胞 24 小时,然后 SET-2 细胞生长 72 小时, TEL-JAK Ba/F3 细胞生长 48 小时。随后在指定生长期加入 Alamar Blue (10 μL/孔), 细胞在 37°C 下 5% CO₂ 环境下温育 2 小时, 然后在 545 (激发光) 和 600 nm (发射光)处测定荧光值。使用 Microsoft Excel 的 Xlfit4 版本 4.22 计算 GI50 值。

【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。