

## XL-019 ; XL019

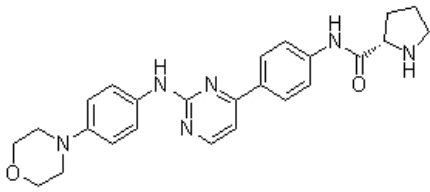
产品编号 : MB4581

质量标准 : >98%,JAK2 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C25H28N6O2	结 构 式	
分子量	444.53		
CAS No.	945755-56-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 16 mg/mL (35.99 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 :** XL019 是 JAK2 选择性抑制剂。

**别名 :** 2-Pyrrolidinecarboxamide,

N-[4-[2-[[4-(4-morpholinyl)phenyl]amino]-4-pyrimidinyl]phenyl]-, (2S)-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....绿色至黄色固体

溶解性 : .....DMSO : 16 mg/mL (35.99 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

<b>产品描述</b>	XL019 是一种有效的, 选择性的 JAK2 抑制剂, IC50 为 2.2 nM, 比作用于 JAK1, JAK3 和
-------------	---

	TYK2.选择性高 50 倍。Phase 1。				
特性	Orally bioavailable JAK2-selective inhibitor and has been tested in Phase I clinical trials for treatment of Myelofibrosis.				
靶点	JAK2	PDGFR $\beta$	JAK1	FLT3	JAK3
	2.2 nM	125.4 nM	134.3 nM	139.7 nM	214.2 nM
体外研究	XL019 是一种高选择性 JAK2 的抑制剂, 结合在 JAK2 的活性位点, 选择性是 JAK1 和 TYK2 的 50 倍。XL019 表现理想的 CYP ( 1A2 , 2C9 , 2D6 , 3A4 $\geq$ 20 $\mu$ M ), hERG ( 16 $\mu$ M ), 和 P-糖蛋白 ( > 20 $\mu$ M ) 的抑制作用。XL019 抑制 JAK2 的活化以及突变形式 JAK2V617F 的, 这可能会导致 JAK-STAT 信号转导途径的抑制, 并且可以诱导细胞凋亡。和其它细胞系统中相比, XL019 在类红细胞中表现超过 10 倍的选择性抑制 ( IC 50 =64 nM )。				
体内研究	在给药 30, 100, 和 300 毫克/千克后, XL019 显著抑制下游标记 pSTAT1 和 pSTAT3, 导致 ED 50 分别为 42 毫克/公斤 ( pSTAT1 ) 和 210 毫克/千克 ( pSTAT3 的 )。XL019 拥有优越的药效和具有良好的口服吸收, 在不同物种中表现适中的清除率和半衰期。在小鼠中, XL019 抑制 HEL.92.1.7 异种移植肿瘤生长, 200 mg / kg 和 300 毫克/公斤分别每天给药两次直至 14 天表现 60%和 70%的抑制作用。和对照相比, 300 毫克/公斤的剂量表现 11.3 倍的增加的细胞凋亡。				

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)

MB3931	<a href="#">NVP-BSK805 2HCl</a>
MB4634	<a href="#">Pacritinib,SB1518</a>
MB5456	<a href="#">SB1317,TG02</a>

**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。XL019 是 JAK2 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 浓	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.2496 mL	11.2478 mL
5 mM		0.4499 mL	2.2496 mL	4.4991 mL

10 mM	0.2250 mL	1.1248 mL	2.2496 mL
50 mM	-	-	-

**经典实验操作（仅供参考）**

<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> HEL.92.1.7 移植体</p> <p><b>Formulation:</b> 水+10 mM 盐酸</p> <p><b>Dosages:</b> 100 毫克/千克, 200 毫克/千克, 300 毫克/千克, bid</p> <p><b>Administration:</b> 口服灌胃</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(M <sup>2</sup> )	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。