

INCB018424) phosphate ; Ruxolitinib(INCB018424) phosphate

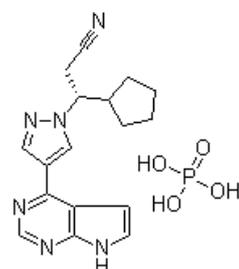
产品编号 : MB5455

质量标准 : >98%,JAK1/2 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C17H18N6.H3PO4	结 构 式	
分子量	404.36		
CAS No.	1092939-17-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 61 mg/mL (199.1 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 : 鲁索利替尼磷酸盐 Ruxolitinib phosphate 是一种有效的 JAK1/2 抑制剂。

别名 : INCB018424 phosphate ; 1H-Pyrazole-1-propanenitrile, .beta.-cyclopentyl-4-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-, (.beta.R)-, phosphate (1:1)

物理性状及指标 :

外观 :白色至灰色固体

溶解性 :DMSO 61 mg/mL (199.1 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol 61 mg/mL (199.1 mM)

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	Ruxolitinib (INCB018424)是第一个应用于临床的, 有效的, 选择性 JAK1/2 抑制剂, 在无细胞试验中 IC50 为 3.3 nM/2.8 nM。作用于 JAK1, JAK2 与作用于 JAK3 相比, 选择性高 130 多倍。	
靶点	JAK2 (Cell-free assay)	JAK1 (Cell-free assay)

	2.8 nM	3.3 nM
体外研究	在 Ba/F3 细胞和 HEL 细胞中, INCB018424 有效地和有选择性地抑制 JAK2V617F 介导的信号传导和细胞增殖。INCB018424 以剂量依赖性的方式显著地增加 Ba/F3 细胞的细胞凋亡。在 Ba/F3 细胞中, INCB018424(64 nM)致使线粒体去极化细胞增加一倍。INCB018424 抑制来自正常捐助者和真性红细胞增多症患者的红细胞前体细胞的增殖, IC50 分别是 407 nM 和 223 nM。INCB018424 有效抑制红细胞集落形成, IC50 是 67 nM。	
体内研究	INCB018424 (180 mg/kg, 口服, 每日两次) 导致 JAK2V617F 驱动的小鼠模型的生存率在处理 22 天后大于 90%。在 JAK2V617F 驱动的小鼠模型中, INCB018424 (180 mg/kg, 口服, 每日两次) 显著降低脾脏肿大和炎症因子的循环水平, 并优先消灭肿瘤细胞, 造成显著延长的生存期, 无骨髓抑制或免疫抑制作用。在骨髓纤维化的双盲试验中, Ruxolitinib 组的主要终点达到 41.9%, 安慰剂组则为 0.7%。Ruxolitinib 导致脾体积持续减少和总症状得分提高 50% 或更多。在 Ruxolitinib (15 mg, 每天两次) 组内, 共 28% 骨髓纤维化患者至 48 周时脾脏体积减少至少 35%, 而接受最好的治疗组的比例为 0%。Ruxolitinib 致使脾脏长度减少了 56%, 而接受最好的治疗组却增加了 4%。Ruxolitinib 组患者的生活质量得到提高和骨髓纤维化相关症状减少。	

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)

MB3932	S-Ruxolitinib (INCB018424)
MB5446	氢溴酸达非那新

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。本品鲁索利替尼磷酸盐 Ruxolitinib phosphate 是一种有效的 JAK1/2 抑制剂, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	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	结合试验: 重组蛋白是使用 Sf21 细胞和杆状病毒载体表达的, 并通过亲和层析纯化。JAK 激酶测定使用肽底物 (-EQEDEPEGDYFEWLE) 的均相时间分辨荧光测定法。酶反应是用 Ruxolitinib 或对照, JAK
-------------	--

	酶, 500 nM 肽, 三磷酸腺苷 (ATP; 1mM), 和 2%的二甲基亚砷 (DMSO) 反应 1 小时。 50%抑制浓度 (IC50) 时需要抑制 50% 荧光信号的 INCB018424 浓度。
细胞实验	<p>Cell lines: Ba/F3 和 HEL 细胞</p> <p>Concentrations: 3 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 2×10^3 细胞接种于的 96 孔板的一个孔中, 用溶于 DMSO 的 INCB018424 (0.2% DMSO 终浓度) 在 37°C 和 5% CO₂ 条件下温育 48 小时。存活率是通过使用细胞滴度格洛荧光素酶试剂或活细胞计数器测定 ATP 水平。数值转换为相对对照的抑制百分率, IC₅₀ 曲线使用 Prism 的 GraphPad 数据的非线性回归分析拟合。</p>
动物实验	<p>Animal Models: JAK2V617F 驱动的小鼠模型</p> <p>Formulation: 5% 二甲基乙酰胺, 0.5% methocellulose</p> <p>Dosages: 180 mg/kg</p> <p>Administration: 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 ²)	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。