

## TG-101209; TG 101209

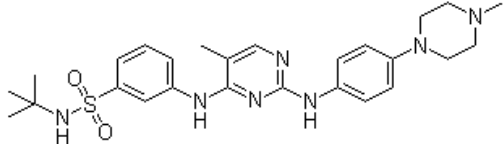
产品编号: MB8031

质量标准: >98%, 选择性 JAK2 抑制剂

包装规格: 5MG;50MG;100MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C26H35N7O2S	结 构 式	
分子量	509.67		
CAS No.	936091-14-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 102 mg/mL (200.12 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:** TG101209 是一种选择性的, 有效的 JAK2 抑制剂; 同时能抑制 Flt3, 和 RET 的活性, 作用效果稍弱。

**别名:** Benzenesulfonamide,

N-(1,1-dimethylethyl)-3-[[5-methyl-2-[[4-(4-methyl-1-piperazinyl)phenyl]amino]-4-pyrimidinyl]amino]-

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至灰色固体

溶解性: .....DMSO: 102 mg/mL (200.12 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>	TG101209 是一种选择性的 JAK2 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为 6 nM, 对 Flt3 和 RET 作用效果稍弱, IC50 分别为 25 nM 和 17 nM, 作用于 JAK2 比作用于 JAK3 选择性高 30 倍左右, 对 JAK2V617F 和 MPLW515L/K 突变型敏感。			
<b>靶点</b>	JAK2	RET	FLT3	JAK3
<b>IC50</b>	6 nM	17 nM	25 nM	169 nM
<b>体外研究</b>	TG101209 是一种口服生物可利用的, 小分子, ATP 竞争性的几种酪氨酸激酶抑制剂。TG101209 抑制表达 JAK2V617F 或 MPLW515L 突变体的 Ba/F3 细胞生长, IC50 为 200 nM。在表达人 JAK2V617F 的急性髓细胞性白血病细胞系中, TG101209 诱导细胞周期阻滞和细胞凋亡, 并抑制 JAK2V617F, STAT5 和 STAT3 磷酸化作用。TG101209 抑制来自负荷 JAK2V617F 或 MPL515			

	突变体的原代祖细胞中造血细胞集落的生长。TG101209 显著减少 STAT5 磷酸化，而不影响 STAT5 蛋白质的总量。在体外 HCC2429 和 H460 肺癌细胞中，TG101209 抑制存活素，并降低 STAT3 的磷酸化作用。TG101209 导致体外 HCC2429 和 H460 肺癌细胞放射致敏。一项最近的研究表明 TG101209 废除 BCR-JAK2 和 STAT5 磷酸化，减少 Bcl-xL 表达，并引起转化的 Ba/F3 细胞凋亡。
<b>体内研究</b>	100 mg/kg TG101209 有效延长 JAK2V617F 诱发的患病(10 天)动物的存活时间。与安慰剂处理的动物相比，TG101209 处理的动物体内循环肿瘤细胞负荷表现出统计学显著的，剂量依赖性减少，在+11 天时减少比例达到 20%。

**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	NVP-BSK805 2HCl
MB4634	Pacritinib,SB1518
MB5456	SB1317,TG02

**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。TG101209 是一种选择性的，有效的 JAK2 抑制剂；同时能抑制 Flt3，和 RET 的活性，作用效果稍弱，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	1.9621 mL	9.8103 mL	19.6205 mL
5 mM	0.3924 mL	1.9621 mL	3.9241 mL
10 mM	0.1962 mL	0.9810 mL	1.9621 mL
50 mM	0.0392 mL	0.1962 mL	0.3924 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>无细胞激酶活性试验:</b></p> <p>对 TG101209 的 IC50 值使用基于荧光的激酶试验通过从 Upstate Cell Signaling Solutions 获得的重组 JAK2, VEGFR2/KDR, 和 JAK3 测定。激酶反应在包含 40mM Tris 缓冲液(pH 7.4), 50mM MgCl<sub>2</sub>, 800mM EGTA, 350mM Triton X-100, 2mM β-巯基乙醇, 100mM 多肽底物, 和适当量 JAK2, VEGFR2/KDR 或 JAK3 的缓冲液中进行, 该试验超过 60 分钟是线性的。反应通过加入 10mL 终浓度为 3mM 的 ATP 起始, 在 60 分钟后加入激酶- Glo 试剂终止。荧光素酶活性使用 Ultra 384 仪器设定为光度测量进行定量。从实验数据得到的 IC50 值使用 GraphPad Prism 4.0 软件的非线性曲线拟合功能得到。对一组 63 个激酶的单剂抑制数据使用 SelectScreen™ 功能测定。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> 表达 JAK2V617F (Ba/F3-EpoR-V617F) 和 MPLW515L (Ba/F3-W515L) 突变体的 Ba/F3 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 4.6-38 400 nM</p> <p><b>Incubation Time:</b> 28-30 小时</p>

	<p><b>Method:</b> 简而言之, 大约 <math>2 \times 10^3</math> 细胞接种到微孔板的 100 ml RPMI-1640 生长培养基, 其中含有指示浓度的 TG101209。细胞的相对生长每隔 24 小时使用细胞增殖试剂盒 II (XTT) 根据制造商指南进行量化。培育后, 将 20 mL XTT 加入孔中, 并培育 4-6 小时。有色甲瓩产物在 450 nm 下分光光度法测定, 分光光度计在 650 nm 下进行校正, IC50 值使用 GraphPad Prism 4.0 软件测定。将数据进行非线性回归拟合分析, IC50 值以抑制 50% 增殖的浓度测定。所有实验以一式三份进行, 结果归一化为未处理细胞的生长情况。</p>
动物实验	<p><b>Animal Models:</b> Ba/F3-V617F-GFP 细胞注射到免疫缺陷的 SCID 小鼠以诱导快速致命的, 完全渗透的造血系统疾病。</p> <p><b>Formulation:</b> TG101209 溶解于 DMSO 中</p> <p><b>Dosages:</b> 100 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> TG101209 以指示剂量口服强饲给药, 在肿瘤细胞输注 3 天后开始给药, 20 天后停止。</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(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。