

AZD1480

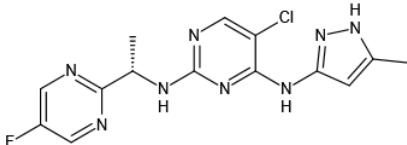
产品信息

产品名称	产品编号	规格
AZD1480	52992ES08	5 mg
	52992ES10	10 mg
	52992ES50	50 mg

产品描述

AZD1480 是一种新型的 ATP 竞争性 JAK2 抑制剂, IC₅₀ 值为 0.26 nM。AZD1480 能够选择性作用于 Tyk2 和 JAK3, 但对 JAK1 的作用较弱。AZD1480 对各种骨髓瘤细胞有效, 可作为治疗多发性骨髓瘤的潜在新型治疗剂。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	AZD1480; AZD 1480; AZD-1480
中文名称 (Chinese Name)	5-氯-N2-[(1S)-1-(5-氟-2-嘧啶基)乙基]-N4-(5-甲基-1H-吡唑-3-基)-2,4-嘧啶二胺
靶点 (Target)	JAK2
CAS 号 (CAS NO.)	935666-88-9
分子式 (Formula)	C ₁₄ H ₁₄ ClFN ₈
分子量 (Molecular Weight)	348.77
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO
结构式 (Structure)	

运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃, 有效期 2 年。建议分装后-20℃避光保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

5 μM AZD1480 处理多种淋巴瘤细胞系, 诱导细胞周期停在 G2/M 期, 且通过抑制 Aurora 激酶而诱导细胞死亡。^[1] 低

浓度的 AZD1480 抑制人骨髓瘤细胞系 (U266 和 Kms.11) 增殖并诱导细胞凋亡, 抑制 FGFR3 和 STAT3 信号。^[2] AZD1480 作用于人和鼠神经胶质瘤细胞, 有效抑制组成型和诱导型 JAK1, JAK2 及 STAT-3 的磷酸化, 导致细胞增殖降低, 诱导凋亡。^[3] 5 μ M 或 10 μ M AZD1480 可抑制 SKOV3 细胞的增殖、侵袭、转移和克隆形成, 诱导细胞凋亡, 提高化疗敏感性, 降低 p-STAT3 蛋白表达水平。^[4]

(二) 动物实验 (体内实验)

在骨髓瘤移植瘤小鼠模型中, 小鼠口服 30 mg/kg 的 AZD1480, 每天两次。持续一周后, 抑制了移植瘤的生长。^[2] 在胶质母细胞瘤皮下移植瘤小鼠模型中, 小鼠腹腔注射 30 mg/kg 的 AZD1480, 每天两次。持续一周后, 抑制了移植瘤的生长。在胶质母细胞瘤原位移植瘤小鼠模型中, 小鼠口服 50 mg/kg 的 AZD1480, 每天一次。持续三周后, 抑制了移植瘤的生长, 增加了小鼠的存活率。^[3] 在小鼠肾癌肺转移模型中, 口服 50 mg/kg 的 AZD1480, 每天一次, 持续 3-6 周后, 抑制了肿瘤的肺转移和肿瘤血管生成。^[5]

参考文献

- [1]. Derenzini E, et al. The JAK inhibitor AZD1480 regulates proliferation and immunity in Hodgkin lymphoma. *Blood Cancer J.* 2011 Dec;1(12):e46.
- [2]. Scuto A, et al. The novel JAK inhibitor AZD1480 blocks STAT3 and FGFR3 signaling, resulting in suppression of human myeloma cell growth and survival. *Leukemia.* 2011 Mar;25(3):538-50.
- [3]. McFarland BC, et al. Therapeutic potential of AZD1480 for the treatment of human glioblastoma. *Mol Cancer Ther.* 2011;10(12):2384-93.
- [4]. Xin Y, et al. AZD1480 can inhibit the biological behavior of ovarian cancer SKOV3 cells in vitro. *Asian Pacific Journal of Cancer Prevention*, 2013;14(8): 4823-4827.
- [5]. Xin H, et al. Antiangiogenic and antimetastatic activity of JAK inhibitor AZD1480. *Cancer Res.* 2011;71(21):6601-10.