

## Tofacitinib

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
	52993ES10	10 mg
Tofacitinib	52993ES50	50 mg
	52993ES60	100 mg

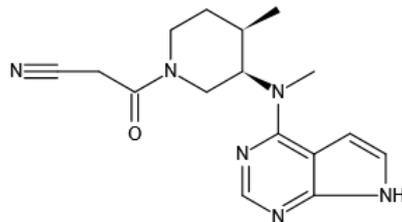
### 产品描述

Tofacitinib (Tasocitinib, CP-690550, CP690550), 也称托法替尼或托法替布, 是一种新型可口服的 JAK3 抑制剂, IC<sub>50</sub> 值为 1 nM, 作用于 JAK1 和 JAK2 的选择性相比于 JAK3 分别低 100 和 20 倍。Tofacitinib 通过抑制 JAK1 和 JAK3 可阻断几种细胞因子的信号, 包括 IL-2、4、7、9、15 和 21。临床上, Tofacitinib 用于治疗对甲氨蝶呤治疗反应不足或不耐受的中度至重度活动性类风湿性关节炎(RA)成人患者。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	Tofacitinib; CP-690550; Tasocitinib; CP690550
中文名称 (Chinese Name)	托法替尼, 托法替布
靶点 (Target)	JAK3
CAS 号 (CAS NO.)	477600-75-2
分子式 (Formula)	C <sub>16</sub> H <sub>20</sub> N <sub>6</sub> O
分子量 (Molecular Weight)	312.37
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO, 不溶于水和酒精

### 结构式 (Structure)



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。建议分装后-20°C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）

在 IL-2 诱导的人 T 细胞中，Tofacitinib 抑制细胞增殖，其 IC<sub>50</sub> 值为 11 nM。在 GM-CSF 诱导的人骨髓单核细胞 HUO3 细胞中，CP-690550 抑制细胞增殖，其 IC<sub>50</sub> 值为 324 nM。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

在异位心脏移植（DBA2 供体心脏移到 C57/BL6 宿主）的小鼠模型中，口服 Tofacitinib 呈剂量依赖性地延长了小鼠存活时间。并且，口服 Tofacitinib 也可以防止非人灵长类(NHPs, *macaca fascicularis*)肾移植动物模型中同种异体肾排斥反应。<sup>[1]</sup> 在关节炎大鼠模型(AIA)中，口服 6.2mg/kg 的 Tofacitinib 后，AIA 大鼠的水肿、炎症和破骨细胞介导的骨吸收减少。<sup>[2]</sup> 口服 Tofacitinib 可逆转大鼠吸入 LPS 导致气道中性粒细胞增多、BALF 中某些细胞因子的水平和肺组织中 STAT3 的磷酸化。<sup>[3]</sup>

## 参考文献

- [1]. Changelian PS, et al. Prevention of organ allograft rejection by a specific Janus kinase 3 inhibitor. *Science*. 2003;302(5646):875-8.
- [2]. LaBranche TP, et al. JAK inhibition with tofacitinib suppresses arthritic joint structural damage through decreased RANKL production. *Arthritis Rheum*. 2012;64(11):3531-42.
- [3]. Calama E, et al. Tofacitinib ameliorates inflammation in a rat model of airway neutrophilia induced by inhaled LPS. *Pulm Pharmacol Ther*. 2017;43:60-67.
- [4]. Jiang JK, et al. Examining the chirality, conformation and selective kinase inhibition of 3-((3R,4R)-4-methyl-3-(methyl(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)amino)piperidin-1-yl)-3-oxopropanenitrile (CP-690,550). *J Med Chem*. 2008;51(24):8012-8.