

Baricitinib

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	52997ES08	5 mg
Baricitinib	52997ES10	10 mg
	52997ES50	50 mg

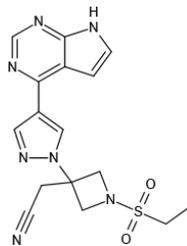
产品描述

Baricitinib (LY3009104, INCB028050, LY-3009104, INCB-028050), 又称巴瑞克替尼, 是一种选择性、ATP 竞争性、可口服的 JAK1/2 抑制剂, IC_{50} 值为 5.9 nM 和 5.7 nM, 对 JAK3 和 Tyk2 抑制活性较低, 对 c-Met 和 Chk2 没有抑制作用。Baricitinib 常用于治疗成人中中度至重度的活动性类风湿关节炎。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Baricitinib, LY3009104, INCB028050, LY-3009104, INCB-028050
中文名称 (Chinese Name)	巴瑞克替尼
靶点 (Target)	JAK1/2
CAS 号 (CAS NO.)	1187594-09-7
分子式 (Formula)	$C_{16}H_{17}N_7O_2S$
分子量 (Molecular Weight)	371.42
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
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°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

- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
- 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 PBMC 中, Baricitinib 抑制由 IL-6 刺激的 STAT3 磷酸化和趋化因子 MCP-1 的生成, IC₅₀ 值分别为 44 nM 和 40 nM。在分离的幼稚 T 细胞中, Baricitinib 还抑制 IL-23 刺激的 pSTAT3 (IC₅₀=20nM)。重要的是, Baricitinib 抑制 Th17 细胞产生的两种致病细胞因子 (IL-17 和 IL-22), IC₅₀ 值为 50 nM。^[1]

(二) 动物实验 (体内实验)

雌性大鼠口服 10 mg/kg 的 Baricitinib, 有效抑制 JAK1/2 信号 (抑制率≥50%) 达 8 h。在佐剂性关节炎大鼠模型中, 口服 1、3 或 10 mg/kg 的 Baricitinib, 使疾病得分降低 24%、57% 和 81%, 骨吸收减少 15%、61% 和 67%。在胶原诱导的关节炎(CIA)小鼠模型中, 口服 10 mg/kg 的 Baricitinib, 将关节损伤的综合评分提高了 47%, 每个单独的参数都有改善: 炎症(43%)、血管翳(53%)、软骨损伤(41%)和骨损伤(53%)。^[1] 每日口服 7 mg Baricitinib, 斑秃患者头发稳定再生, 直到治疗九个月后完全解决了脱发问题。C3H/HeJ 移植的脱发小鼠口服 0.7 mg Baricitinib, 炎症显著减少, CD8 浸润减少, MHC I 类和 II 类表达降低。^[2]

参考文献

- [1]. Fridman JS, et al. Selective inhibition of JAK1 and JAK2 is efficacious in rodent models of arthritis: preclinical characterization of INCB028050. *J Immunol.* 2010;184 (9):5298-307.
- [2]. Jabbari A, et al. Reversal of Alopecia Areata Following Treatment With the JAK1/2 Inhibitor Baricitinib. *EBioMedicine.* 2015;2 (4):351-5.
- [3]. Khan IM, et al. Intermuscular and perimuscular fat expansion in obesity correlates with skeletal muscle T cell and macrophage infiltration and insulin resistance. *Int J Obes (Lond).* 2015;39 (11):1607-18.