

## S-Ruxolitinib

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
S-Ruxolitinib	53019ES08	5 mg
	53019ES25	25 mg

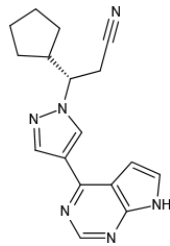
### 产品描述

S-Ruxolitinib 是 Ruxolitinib (INCB018424, INC424) S 型对映体, Ruxolitinib 是具有口服活性、第一个应用到临床的选择性 JAK1/2 抑制剂, IC<sub>50</sub> 值为 3.3 nM/2.8 nM, 其选择性是作用于 Tyk2 的 6 倍, 是 JAK3 的 130 倍。Ruxolitinib 用于治疗中间或高危骨髓纤维化, 并且具有强效的抗肿瘤和免疫调节活性。Ruxolitinib 选择性抑制 Ba/F3-EpoR-JAK2 V617F 细胞增殖, 而且会导致磷酸化 JAK2 和 STAT5 信号转导和激活剂水平降低。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	S-Ruxolitinib, S-INCB018424, S-INC424
中文名称 (Chinese Name)	S-鲁索替尼
靶点 (Target)	JAK1/2
CAS 号 (CAS NO.)	941685-37-6
分子式 (Formula)	C <sub>17</sub> H <sub>18</sub> N <sub>6</sub>
分子量 (Molecular Weight)	306.37
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO 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）

用 INCB018424 处理 Ba/F3-EpoR-JAK2 V617F 细胞,抑制 JAK2 V617F 介导的信号和增殖,IC<sub>50</sub> 值为 126 nM。INCB018424 抑制从正常供体和真性红细胞增多症患者分离的红系祖细胞的增殖, IC<sub>50</sub> 分别为 407 nM 和 223 nM。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

骨髓增殖性肿瘤小鼠模型中,小鼠口服 180 mg/kg 的 INCB018424,显著减少了脾肿大和炎性细胞因子的循环水平,并提高了小鼠存活率。<sup>[1]</sup> 中危或高危骨髓纤维化患者每日两次口服 15 或 20 mg 的 INCB018424,48 周后,脾脏体积变小、改善衰弱性骨髓纤维化相关症状,提高总体生存率。<sup>[2]</sup>

### 参考文献

- [1]. Quintas-Cardama A, et al. Preclinical characterization of the selective JAK1/2 inhibitor INCB018424: therapeutic implications for the treatment of myeloproliferative neoplasms. *Blood*, 2010;115(15), 3109-3117.
- [2]. Verstovsek S, et al. A double-blind, placebo-controlled trial of ruxolitinib for myelofibrosis. *N Engl J Med*. 2012;366(9), 799-807.
- [3]. John Mascarenhas, Ronald Hoffman. Ruxolitinib: The First FDA Approved Therapy for the Treatment of Myelobrosis. *Clinical Cancer Research*. 2012;18(11): 3008-3014.