

HB181212

CYT387

产品信息

产品名称	产品编号	规格
CYT387	51902ES10	10 mg
CYT387	51902ES50	50 mg

产品描述

CYT387 又称为 momelotinib, 是一种新型、ATP 竞争性的 JAK1 和 JAK2 抑制剂, IC₅₀ 分别为 11 nM 和 18 nM, 比作用于其他激酶如 JAK3 的活性约高 10 倍左右 (IC₅₀=0.16 μM)。CYT387 抑制多种细胞生长, 如 MM 细胞和人白血病细胞, 另外, 在 JAK2 依赖的造血细胞系中, CYT387 抑制细胞生长, 诱导细胞凋亡。

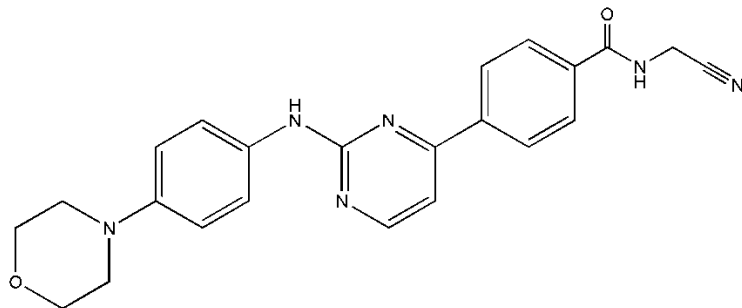
CYT387 具有口服生物活性, 目前已用于临床 Phase 3 阶段。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Momelotinib, CYT-387
化学名 (Chemical Name)	N-(cyanomethyl)-4-[2-[[4-(4-morpholinyl)phenyl]amino]-4-pyrimidinyl]-benzamide
靶点 (Target)	JAK1/2
CAS 号 (CAS NO.)	1056634-68-4
分子式 (Molecular Formula)	C ₂₃ H ₂₂ N ₆ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	414.46
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20 ℃, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后-20 ℃ 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

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) 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。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

细胞实验中，用不同浓度 CYT387(0-5 μM)处理 Ba/F3 细胞，免疫印迹结果显示，当 CYT387 浓度大于 2 μM 时，phospho-JAK2 水平显著降低；在 CYT387 浓度大于 0.3 μM 时，磷酸化 ERK1/2 和磷酸化 STAT5 水平明显降低。^[2]

（二）动物实验（体内研究）

体内实验中，发现 50、100 mg/kg CYT387 对外周血数量几乎没有影响；用 25、50 mg/kg CYT387 处理 Balb/c 小鼠后，检测血浆浓度，发现，12 h 内平均血浆峰值浓度分别从 7.1 μM 降到 10 nM（25 mg/kg），从 32.1 μM 降到 900 nM（50 mg/kg）。^[2]

参考文献

- [1] Pardanani A, et al. CYT387, a selective JAK1/JAK2 inhibitor: in vitro assessment of kinase selectivity and preclinical studies using cell lines and primary cells from polycythemia vera patients. *Leukemia*, 23(8): 1441-1445 (2009).
- [2] Tyner JW, et al. CYT387, a novel JAK2 inhibitor, induces hematologic responses and normalizes inflammatory cytokines in murine myeloproliferative neoplasms. *Blood*, 115(25): 5232-5240 (2010).
- [3] Monaghan KA, et al. The novel JAK inhibitor CYT387 suppresses multiple signalling pathways, prevents proliferation and induces apoptosis in phenotypically diverse myeloma cells. *Leukemia*, 25(12): 1891-1899 (2011).
- [4] Deshpande A, et al. Kinase domain mutations confer resistance to novel inhibitors targeting JAK2V617F in myeloproliferative neoplasms. *Leukemia* 26(4): 708-715 (2012).
- [5] Furqan M, et al. Dysregulation of JAK-STAT pathway in hematological malignancies and JAK inhibitors for clinical application. *Biomark. Res.* 1(1): 1-10 (2013).
- [6] Abubaker K, et al. Inhibition of the JAK2/STAT3 pathway in ovarian cancer results in the loss of cancer stem cell-like characteristics and a reduced tumor burden. *BMC Cancer* 14: 1-22 (2014).