

HB181213

Ruxolitinib

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Ruxolitinib	51905ES08	5 mg
Ruxolitinib	51905ES25	25 mg

产品描述

Ruxolitinib 又称为 INCB018424、INCB18424, 是一种强效的、选择性 JAK1 和 JAK2 抑制剂, IC₅₀ 分别为 3.3 nM 和 2.8 nM, 其选择性是作用于 Tyk2 的 6 倍, 是 JAK3 的 130 倍。Ruxolitinib 选择性抑制 JAK2V617F⁺ Ba/F3 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。

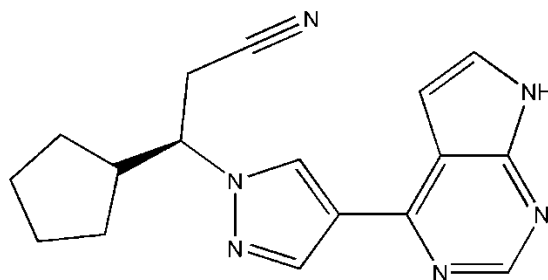
Ruxolitinib 具有口服生物活性, 具有强效的抗肿瘤和免疫调节活性, 是第一个用于临床的 JAK1/JAK2 抑制剂, 已用于 MPNs (包括 MF、PV、ET) 的临床应用。

【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)	INCB018424, INCB18424
化学名 (Chemical Name)	β R-cyclopentyl-4-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pyrazole-1-propanenitrile
靶点 (Target)	JAK1/2
CAS 号 (CAS NO.)	941678-49-5
分子式 (Molecular Formula)	C ₁₇ H ₁₈ N ₆
分子量 (Molecular Weight)	306.37
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）

为检测 Ruxolitinib (INCB018424) 的活性，用不同浓度的 Ruxolitinib (0-3000 nM) 分别孵育 Ba/F3-EpoR-JAK2V617F 和 HEL 细胞 2.5 hr，Western blot 结果分析显示，当浓度超过 51 nM 时，JAK2、STAT5 和 ERK1/2 磷酸化水平随剂量升高而降低，约 300 nM 时达到最大抑制效果。^[2]

（二）动物实验（体内研究）

体内实验中，给 Balb/c 小鼠尾静脉注射 Ba/F3-EpoR-JAK2V617F 细胞后，用 Ruxolitinib 处理小鼠，22 天后，对照组小鼠死亡率超过 90%，而 Ruxolitinib 处理组 90% 存活。另外，对照组小鼠明显地出现脾肿大现象，重量为 471 mg（正常组的 5 倍）；而 Ruxolitinib 处理组小鼠脾重量为 110 mg。^[2]

参考文献

- [1] Verstovsek S, et al. INCB018424, an oral, selective JAK2 inhibitor, shows significant clinical activity in a phase I/II study in patients with primary myelofibrosis (PMF) and post polycythemia vera/essential thrombocythemia myelofibrosis (post-PV/ET MF). Blood (ASH Annual Meeting Abstracts) 110: 558 (2007)
- [2] Quint & Cardama A, et al. Preclinical characterization of the selective JAK1/2 inhibitor INCB018424: therapeutic implications for the treatment of myeloproliferative neoplasms. Blood 115: 3109-3117 (2010).
- [3] Verstovsek S, et al. Safety and efficacy of INCB018424, a JAK1 and JAK2 inhibitor, in myelofibrosis. N. Engl. J. Med. 363: 1117-1127 (2010).
- [4] Verstovsek S, et al. A double-blind, placebo-controlled trial of ruxolitinib for myelofibrosis. N Engl J Med, 366(9): 799-807 (2012).
- [5] Harrison C, et al. JAK Inhibition with Ruxolitinib versus Best Available Therapy for Myelofibrosis. N Engl J Med, 366(9): 787-798 (2012).