

HB181214

GLPG0634

产品信息

产品名称	产品编号	规格
GLPG0634	51910ES08	5 mg

产品描述

GLPG0634 又称为 Filgotinib, 是一种口服生物活性的、选择性 JAK1 抑制剂 ($IC_{50}=10$ nM, $K_d=11$ nM), 并抑制 JAK2、JAK3 和 TYK2, IC_{50} 分别为 28 nM、810 nM 和 116 nM。GLPG0634 有效抑制 Th1、Th2 和 Th17 分化。另外, 在胶原诱导的类风湿模型中, GLPG0634 具有明显作用, 导致足肿胀、软骨以及骨降解、炎症因子水平明显降低。

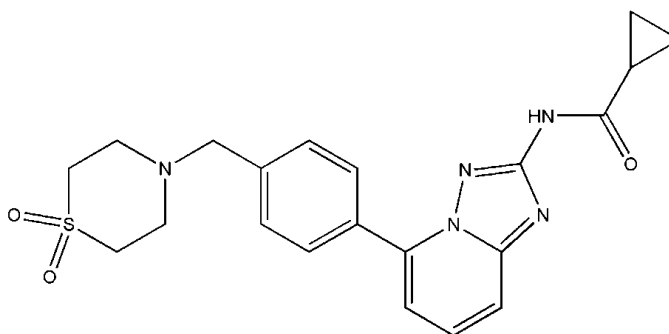
目前, GLPG0634 已用于类风湿关节炎 (RA) 的 Phase 2B, 以及克罗恩病 (Crohn's disease, CD) 的 Phase 2A 研究阶段。

【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)	Filgotinib
化学名 (Chemical Name)	N-[5-[4-[(1,1-dioxo-1,4-thiazinan-4-yl)methyl]phenyl]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyridin-2-yl]cyclopropanecarboxamide
靶点 (Target)	JAK1
CAS 号 (CAS NO.)	1206161-97-8
分子式 (Molecular Formula)	$C_{21}H_{23}N_5O_3S$
分子量 (Molecular Weight)	425.5
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	>98%
溶解性 (Solubility)	微溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20 °C, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后 -20 °C 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 GLPG0634 对细胞的作用，用 anti-CD3/anti-CD28 抗体刺激人 CD4⁺ T 细胞后，用 0.1、1、10 μM GLPG0634 孵育细胞，通过检测 IFN-γ 或 IL-13 mRNA 表达分析 Th1 和 Th2 分化，GLPG0634 剂量依赖性地抑制 Th1 和 Th2 细胞分化。^[1]

（二）动物实验（体内研究）

在体内实验中，给大鼠口服 GLPG0634（1-10 mg/kg），正常 Mx2 mRNA 水平显著降低，在 10 mg/kg 剂量时出现更明显地降低。^[1]

参考文献

- [1] Rompaey LV, et al. Preclinical Characterization of GLPG0634, a Selective Inhibitor of JAK1, for the Treatment of Inflammatory Diseases. *The Journal of Immunology* 191(7): 3568-3577 (2013).
- [2] Menet CJ, et al. Triazolopyridines as Selective JAK1 Inhibitors: From Hit Identification to GLPG0634. *J. Med. Chem.*, 57 (22): 9323-9342 (2014).
- [3] Namour F, et al. AB0460 G1pg0634, A Selective JAK1 Inhibitor, Confirms Its Low Liability for Drug-Drug Interactions. *Ann Rheum Dis* 73: 960 (2014).
- [4] Namour F, et al. Pharmacokinetics and Pharmacokinetic/Pharmacodynamic Modeling of Filgotinib (GLPG0634), a Selective JAK1 Inhibitor, in Support of Phase IIB Dose Selection. *Clinical Pharmacokinetics* 54(8): 859-874 (2015).