

NVP-BSK805

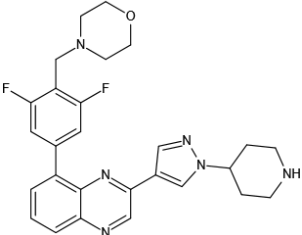
产品信息

产品名称	产品编号	规格
NVP-BSK805	51908ES08	5 mg

产品描述

NVP-BSK805 是一种有效的, 选择性的, ATP 竞争性 JAK2 抑制剂(K_i : 0.43 ± 0.02 nmol/L), IC_{50} 为 0.58 nM, 比作用于 JAK1, JAK3 和 TYK2 选择性高 20 倍以上。NVP-BSK805 对 JAK2 JH1 (JAK 同源 1), JAK1 JH1, JAK3 JH1, 和 TYK2 JH1 的 IC_{50} 值分别为 0.48 nM, 31.63 nM, 18.68 nM 和 10.76 nM。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	NVP-BSK805
中文名称 (Chinese Name)	8-[3,5-二氟-4-(4-吗啉基甲基)苯基]-2-[1-(4-哌啶基)-1H-吡唑-4-基]喹喔啉
靶点 (Target)	JAK2
CAS 号 (CAS NO.)	1092499-93-8
分子式 (Formula)	$C_{27}H_{28}F_2N_6O$
分子量 (Molecular Weight)	490.55
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO ≥ 10 mM
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)

用不同浓度的 NVP-BSK805 处理稳定表达 JAK2 V617F 的 Ba/F3 细胞，抑制了 STAT5 磷酸化和细胞增殖，且诱导细胞凋亡，GI50<100 nM。^[1] 500 nM 的 NVP-BSK805 处理 SET-2 和 MB-02 细胞，会触发 Bim 激活，诱导细胞死亡。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

在 rhEpo 诱导的红细胞增多症小鼠模型中，口服不同浓度（50, 75 或 100mg/kg）的 NVP-BSK805，有效抑制 rhEpo 诱导的 STAT5 磷酸化反应、rhEpo 调节的红细胞增多和脾肿大。^[1]

参考文献

- [1]. Baffert F, et al. Potent and selective inhibition of polycythemia by the quinoxaline JAK2 inhibitor NVP-BSK805. *Mol Cancer Ther.* 2010;9(7):1945-55.
- [2]. Rubert J, et al. Bim and Mcl-1 exert key roles in regulating JAK2 V617F cell survival. *BMC cancer*, 2011;11(1): 1.