

## Decernotinib (VX-509)

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
Decernotinib (VX-509)	53508ES05	2 mg
	53508ES10	10 mg

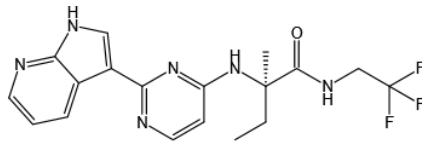
### 产品描述

Decernotinib (VX-509, VX509, VRT-831509, VRT831509), 又称德塞替尼或地诺替尼, 是一种高效的、可口服的 JAK3 抑制剂,  $K_i$  为 2.5 nM, 细胞实验中  $IC_{50}$  为 50-170 nM; 作用于 JAK1/2 和 TYK2 的  $K_i$  值分别为 11、13 和 11 nM。JAK3 主要在免疫细胞中表达, 在许多疾病的免疫应答中有重要作用, 如类风湿性关节炎。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	Decernotinib, VX-509, VX509
中文名称 (Chinese Name)	德塞替尼; 地诺替尼
靶点 (Target)	JAK3
通路 (Pathway)	JAK/STAT
CAS 号 (CAS NO.)	944842-54-0
分子式 (Formula)	$C_{18}H_{19}F_3N_6O$
分子量 (Molecular Weight)	392.38
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

### 结构式 (Structure)



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于  $-20^{\circ}\text{C}$ , 有效期 3 年。建议分装后  $-20^{\circ}\text{C}$  干燥保存, 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)

Decernotinib 有效阻断 T 细胞增殖, 平均 IC<sub>50</sub> 为 170±101 nM, 并抑制 IL-2 刺激的 T 细胞增殖。VX-509 对 CD40L 和 IL-4 的反应也对 B 细胞具有细胞毒性(IC<sub>50</sub>: 50 nM)。<sup>[1]</sup>

## (二) 动物实验 (体内实验)

在胶原诱导的关节炎大鼠模型中, VX-509 (50 mg/kg, p.o.)导致裸关节肿胀和爪重量剂量依赖性减轻, 并改善爪子组织病理学。在恶唑酮诱导的迟发性过敏小鼠模型中, VX-509 (50 mg/kg, p.o.)显著抑制耳朵水肿。<sup>[1]</sup> 在大鼠 HvG 模型中, VX-509 (50 mg/kg, p.o.)导致腭淋巴结(PLN)增生剂量依赖性抑制。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

- [1]. Mahajan S, et al. VX-509 is a potent and selective Janus kinase 3 (JAK3) inhibitor that attenuates inflammation in animal models of autoimmune disease. *J Pharmacol Exp Ther.* 2015 May;353(2):405-14.
- [2]. Farmer LJ, et al. Discovery of VX-509 (Decernotinib): A Potent and Selective Janus Kinase 3 Inhibitor for the Treatment of Autoimmune Diseases. *J Med Chem.* 2015 Sep 24;58(18):7195-216.