

Oclacitinib maleate 奥拉替尼马来酸盐

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Oclacitinib maleate 奥拉替尼马来酸盐	53525ES08	5 mg
	53525ES25	25 mg

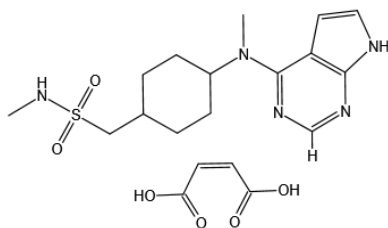
产品描述

Oclacitinib maleate (PF-03394197 maleate, PF03394197 maleate), 又称奥拉替尼马来酸盐, 是一种新型可口服的 JAK 抑制剂, IC_{50} 分别为 10-99 nM, 对 JAK1 最有效, IC_{50} 为 10 nM。Oclacitinib 也能抑制 JAK1 依赖性细胞因子, IC_{50} 为 36-249 nM。Oclacitinib maleate 可用于各种瘙痒性皮肤病, 快速止痒抗炎。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Oclacitinib maleate, PF-03394197 maleate, PF03394197 maleate
中文名称 (Chinese Name)	奥拉替尼马来酸盐
靶点 (Target)	JAK
通路 (Pathway)	JAK/STAT--JAK
CAS 号 (CAS NO.)	1640292-55-2
分子式 (Formula)	$C_{19}H_{27}N_5O_6S$
分子量 (Molecular Weight)	453.51
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°C , 有效期 3 年。建议分装后 -20°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）

在小鼠耳外植体中，Tofacitinib (0.1%)和 Oclacitinib (0.1%)减少小鼠耳外植体的细胞迁移，MHC II 阳性细胞（郎格罕细胞）减少。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

在皮炎小鼠模型中，给药 Oclacitinib (45 mg/kg)，小鼠抓挠次数减少。^[2] 在过敏性皮炎犬瘙痒的犬模型中，口服 PF-03394197 (0.4-0.6 mg/kg)，对于治疗由于变应性皮炎带来的瘙痒是安全有效的。在治疗期间，施以 Oclacitinib 可在 24 小时内缓解发痒，在实验中，超过 70%的实验动物在第 7 天时减轻了大于 50%的瘙痒反应。^[3]

参考文献

- [1]. Gonzales AJ, et al. Oclacitinib (APOQUEL) is a novel Janus kinase inhibitor with activity against cytokines involved in allergy. J Vet Pharmacol Ther. 2014 Aug;37(4):317-24.
- [2]. Fukuyama T, et al. Topically Administered Janus-Kinase Inhibitors Tofacitinib and Oclacitinib Display Impressive Antipruritic and Anti-Inflammatory Responses in a Model of Allergic Dermatitis. J Pharmacol Exp Ther. 2015 Sep;354(3):394-405.
- [3]. Cosgrove SB, et al. Efficacy and safety of oclacitinib for the control of pruritus and associated skin lesions in dogs with canine allergic dermatitis. Vet Dermatol. 2013 Oct;24(5):479-e114.