

Abrocitinib

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Abrocitinib	53554ES05	2 mg
	53554ES08	5 mg

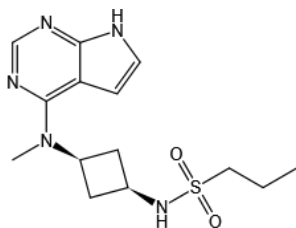
产品描述

Abrocitinib (PF-04965842, PF04965842), 又称阿布罗替尼, 是一种可口服的 JAK1 选择性抑制剂, IC_{50} 为 29 nM, 可用于自身免疫性疾病。JAK1 的过表达与突变与肿瘤发生发展密切相关。Abrocitinib 作用于 JAK2/3 和 TYK2 的 IC_{50} 值分别为 803 nM、 $>10 \mu M$ 和 1.253 μM 。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Abrocitinib, PF-04965842, PF04965842
中文名称 (Chinese Name)	阿布罗替尼
靶点 (Target)	JAK1
通路 (Pathway)	JAK/STAT--JAK
CAS 号 (CAS NO.)	1622902-68-4
分子式 (Formula)	$C_{14}H_{21}N_5O_2S$
分子量 (Molecular Weight)	323.41
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 $-20^{\circ}C$, 有效期 3 年。建议分装后 $-20^{\circ}C$ 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）

Abrocitinib 抑制 IFN α 刺激的 STAT3 磷酸化, IFN 刺激的人全血中 STAT1 的磷酸化, IC₅₀ 分别为 189 和 163 nM。 [1]

（二）动物实验（体内实验）

在大鼠中, 静脉注射 1 mg/kg 或口服 3 mg/kg PF-04965842, 其在体内的清除率相对于整体肝血流量低, CL=26.6 mL/min/kg, Vdss=1.04 L/kg, T_{1/2}=1.1 h。PF-04965842 的口服生物利用度为 95.6%。在佐剂性关节炎大鼠模型中, PF-04965842 剂量依赖性减少爪子肿胀。 [1]

参考文献

[1]. Vazquez ML, et al. Identification of N-{cis-3-[Methyl(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)amino]cyclobutyl}propane-1-sulfonamide (PF-04965842): A Selective JAK1 Clinical Candidate for the Treatment of Autoimmune Diseases. J Med Chem. 2018 Feb 8;61(3):1130-1152.