

Ibrutinib 依鲁替尼

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Ibrutinib 依鲁替尼	53636ES08	5 mg
	53636ES50	50 mg

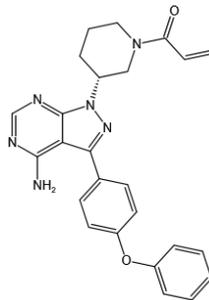
产品描述

Ibrutinib (PCI-32765, PCI32765), 又称依鲁替尼、伊布鲁替尼或伊布替尼, 是一种不可逆的 Btk 选择性抑制剂, IC₅₀ 值为 0.5 nM, 可用于治疗慢性淋巴细胞白血病和套细胞淋巴瘤。Ibrutinib 与 BTK 活性位点上 Cys481 共价结合, 阻碍 Btk 活性, 进而抑制 BCR 信号通路活化, BCR 信号通路对 B 淋巴细胞的增殖、分化和信息传递至关重要。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Ibrutinib, PCI-32765, PCI32765
中文名称 (Chinese Name)	依鲁替尼, 伊布替尼, 伊布鲁替尼
靶点 (Target)	Btk
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase--Btk
CAS 号 (CAS NO.)	936563-96-1
分子式 (Formula)	C ₂₅ H ₂₄ N ₆ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	440.50
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥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）

Ibrutinib 作用于 BCR 通路激活的 DOHH2 细胞系，抑制 Btk 自磷酸化、Btk's 底物 PLC γ 磷酸化和更远一点的下游激酶 ERK 的磷酸化，IC₅₀ 分别为 11 nM、29 nM 和 13 nM。^[1] 依鲁替尼(0.1 μ M)抑制 CLL 细胞增殖，诱导细胞毒性。^[2] Ibrutinib 抑制 BCR 激活的原代 B 细胞增殖，IC₅₀ 为 8 nM，且抑制原代单核细胞中 TNF α 、IL-1 β 和 IL-6 产量，IC₅₀ 分别为 2.6 nM、0.5 nM 和 3.9 nM。^[3]

（二）动物实验（体内实验）

在关节炎小鼠模型中，口服 Ibrutinib (3.125-50 mg/kg)通过抑制 B 细胞活性，显著降低足肿胀和关节发炎等临床关节炎症状。Ibrutinib 作用于 MRL-Fas (lpr)狼疮模型，降低肾疾病和自身抗体产量。^[1] 依鲁替尼剂量依赖性且有效地逆转治疗性 CIA 模型中的关节炎性炎症，ED₅₀ 为 2.6 mg/kg/天。依鲁替尼也可预防 CAIA 模型中的临床关节炎。^[3]

参考文献

- [1]. Honigberg LA, et al. The Bruton tyrosine kinase inhibitor PCI-32765 blocks B-cell activation and is efficacious in models of autoimmune disease and B-cell malignancy. *Proc Natl Acad Sci U S A*. 2010 Jul 20;107(29):13075-80.
- [2]. Herman SE, et al. Bruton tyrosine kinase represents a promising therapeutic target for treatment of chronic lymphocytic leukemia and is effectively targeted by PCI-32765. *Blood*. 2011 Jun 9;117(23):6287-96.
- [3]. Chang BY, et al. The Bruton tyrosine kinase inhibitor PCI-32765 ameliorates autoimmune arthritis by inhibition of multiple effector cells. *Arthritis Res Ther*. 2011 Jul 13;13(4):R115.