



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: JANEX-1
CAS 号: 202475-60-3
产品货号: S88068

生物活性:				
Description	JANEX-1 (WHI-P131) 是一种有效的特异性 JAK3 抑制剂, Ki 为 2.3 μ M, IC50 为 78 μ M, JANEX-1 不抑制 JAK1 和 JAK2。			
IC50 & Target[1]	JAK3 78 μ M (IC50)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	L929	IC ₅₀	14.5 μ M	Inhibition of LPS-induced TNF α production in mouse L929 cells after 4 hrs by ELISA
	Medulloblastoma cell	EC ₅₀	1.525 μ M	Antiproliferative activity against mouse medulloblastoma cells harboring heterozygous ptch1 gene by MTT assay
	RAW	IC ₅₀	1 ng/mL	Inhibition of LPS-induced TNF α production in mouse RAW 264.7 cells at 100 ug/mL after 4 hrs by ELISA
	RAW	IC ₅₀	124.5 μ M	Inhibition of LPS-induced TNF α production in mouse RAW 264.7 cells after 4 hrs by ELISA
	RAW	IC ₅₀	32 ng/mL	Inhibition of LPS-induced TNF α production in mouse RAW 264.7 cells at 10 ug/mL after 4 hrs by ELISA
	RAW	IC ₅₀	4.8 ng/mL	Inhibition of LPS-induced TNF α production in mouse RAW 264.7 cells at 1 ug/mL after 4 hrs by ELISA
	Sf21	IC ₅₀	2800 nM	Inhibition of recombinant His-tagged human KDR expressed in insect Sf21 cells preincubated for 15 mins followed by substrate addition measured after 20 mins by HTRF assay
	Sf9	IC ₅₀	> 1000 nM	Inhibition of human recombinant GST-tagged JH1 domain (785 to 1125) of JAK3 expressed in insect Sf9 cells by ELISA
	T-cell	IC ₅₀	> 10000 nM	Inhibition of IL2-induced proliferation of human T cells assessed as [3H]thymidine incorporation after 72 hrs by scintillation counting
In Vitro	JANEX-1 (WHI-P131) 显示出有效的 JAK3 抑制活性 (IC50 为 78 μM), 不抑制 JAK1 和 JAK2、ZAP/SYK 家族酪氨酸激酶 SYK、TEC 家族酪氨酸激酶 BTK、SRC 家族酪氨酸激酶 LYN 或受体家族酪氨酸激酶胰岛素受体激酶, 即使浓度高达 350 μM[1]。 JANEX-1 在表达 JAK3 的人白血病细胞系 NALM-6 和 LC1; 19 中诱导细胞凋亡, 但在黑色素瘤 (M24-MET) 或鳞状细胞癌 (SQ20B) 细胞中没有。JANEX-1 抑制 JAK3 阳性白血病细胞系 DAUDI、RAMOS、LC1; 19、NALM-6、MOLT-3 和 HL-60 (但不抑制 JAK3 阴性 BT-20 乳腺癌、M24-MET 黑色素瘤) 的克隆生长, 或 SQ20B 鳞状癌细胞系) 以浓度依赖性方式[1]。 JANEX-1 以浓度依赖性方式抑制克隆形成, NALM-6 细胞的 EC50 为 24.4 μM, DAUDI 细胞为 18.8 μM。在 100 μM 时, JANEX-1 抑制白血病细胞系的体外集落形成 >99%。相反, JANEX-1 不抑制 JAK3 阴性 M24-MET 黑色素瘤或 SQ20B 鳞状癌细胞系的克隆形成[1]。			
In Vivo	JANEX-1 (WHI-P131) (5 -100 mg/kg) CPK 活性评估揭示了剂量反应曲线, ED50 值为 7.44 mg/kg。 JANEX-1 处理的小鼠显示 CPK 和 LDH 水平显著降低。此外, 与 I/R 手术小鼠 (65.64$\pm$3.76%) 相比, JANEX-1 处理小鼠的梗塞面积 (30.16$\pm$2.79%) 显著减少[2]。			



	JANEX-1 吸收迅速, 达到最大血浆 JANEX-1 浓度 (tmax) 的时间为 24.7±1.7 min。JANEX-1 被快速消除, 消除半衰期为 45.6±5.5 分钟。尽管预测的最大血浆 JANEX-1 浓度为 10.5 ± 0.8 μM, 仅为相同推注剂量静脉注射后 Cmax 的一半, 但腹腔注射; 生物利用度为 94.6%, 全身暴露水平 (即 AUC) 与静脉注射后观察到的结果非常相似 (17.1±2.2 μM?h 对比 18.1±1.2 μM?h)[3]。	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (336.35 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown	
	<table><tr><th rowspan="4">Preparing <</th></tr></table>	Preparing <
	Preparing <	



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Sudbeck EA, et al. Structure-based design of specific inhibitors of Janus kinase 3 as apoptosis-inducing antileukemic agents. Clin Cancer Res. 1999 Jun;5(6):1569-82. [2]. Oh YB, et al. Inhibition of Janus activated kinase-3 protects against myocardial ischemia and reperfusion injury in mice. Exp Mol Med. 2013 May 17;45:e23 [3]. Uckun FM, et al. In vivo toxicity and pharmacokinetic features of the janus kinase 3 inhibitor WHI-P131 [4-(4'hydroxyphenyl)-amino-6,7- dimethoxyquinazoline. Clin Cancer Res. 1999 Oct;5(10):2954-62. [4]. Xia F, et al. IL4 (interleukin 4) induces autophagy in B cells leading to exacerbated asthma. Autophagy. 2018;14(3):450-464.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year. -80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.3635 mL	16.8175 mL	33.6349 mL	84.0873 mL
	5 mM	0.6727 mL	3.3635 mL	6.7270 mL	16.8175 mL
	10 mM	0.3363 mL	1.6817 mL	3.3635 mL	8.4087 mL
	15 mM	0.2242 mL	1.1212 mL	2.2423 mL	5.6058 mL
	20 mM	0.1682 mL	0.8409 mL	1.6817 mL	4.2044 mL
	25 mM	0.1345 mL	0.6727 mL	1.3454 mL	3.3635 mL
	30 mM	0.1121 mL	0.5606 mL	1.1212 mL	2.8029 mL
	40 mM	0.0841 mL	0.4204 mL	0.8409 mL	2.1022 mL
	50 mM	0.0673 mL	0.3363 mL	0.6727 mL	1.6817 mL
	60 mM	0.0561 mL	0.2803 mL	0.5606 mL	1.4015 mL
	80 mM	0.0420 mL	0.2102 mL	0.4204 mL	1.0511 mL
	100 mM	0.0336 mL	0.1682 mL	0.3363 mL	0.8409 mL