

Catalog Number: CM04892

产品信息

Catalog Number:
CM04892

CAS号:
1206161-97-8

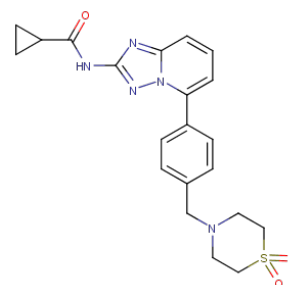
分子式:
C₂₁H₂₃N₅O₃S

主要靶点:
Tyrosine Kinases|JAK

主要通路:
干细胞|血管生成|JAK/STAT信号通路|表观遗传|蛋白酪氨酸激酶

分子量:
425.5

溶解度:
DMSO:79 mg/mL (185.7 mM), Ethanol:<1 mg/mL, H₂O:<1 mg/mL



靶点活性

JAK3:810 nM|JAK2:28 nM|Tyk2:116 nM|JAK1:10 nM

体外活性

对DSS处理小鼠的体内研究显示,Filgotinib (GLPG0634)对JAK1的抑制在临床前小鼠模型中完全可发挥较好的疗效,在发炎的结肠中与STAT3磷酸化的抑制相关.口服给药Filgotinib的绝对生物利用度在大鼠体内适中(45%),而在小鼠体内很高(~100%).在大鼠和小鼠CIA模型中,Filgotinib (30 mg/kg/day,大鼠;50 mg/kg,2次/day,小鼠)可剂量依赖性减少软骨,炎症和骨退化现象.

体内活性

在细胞系中,GLPG0634抑制IL-2/4诱导的JAK1/JAK3/γ c信号和IFN-α B2诱导的JAK1/TYK2 II型受体信号(IC₅₀: 150-760 nM)。与JAK/STAT信号中JAK1激酶相比,在细胞水平上GLPG0634对JAK2激酶的选择性更高。此外,GLPG0634也会抑制Th1/2/17细胞的分化。

描述

GLPG0634(filgotinib) is a selective JAK1 inhibitor. The IC₅₀ values against JAK1, JAK2, JAK3, and TYK2 are 10 nM, 28 nM, 810 nM, and 116 nM, respectively.

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 2 years