

## JAK/STAT 抑制剂

Janus 激酶 (JAKs) 和信号转导及转录激活因子 (STATs) 是信号级联反应中的两个主要组分, 负责将细胞外信号传递至细胞膜并进入细胞核, 进而改变基因转录。JAK/STAT 信号通路参与细胞生长、分化、生存及抗病原反应; 该通路的组分在多种细胞类型中表达, 但在免疫细胞中尤为显著。该通路介导干扰素、细胞因子和生长因子的作用。JAK/STAT 信号通路的失调与多种疾病的发生发展密切相关。STATs 是转录因子, 能够结合 DNA 的启动子区域并诱导下游 DNA 序列的表达。在一些癌症中, STAT3 和 STAT5 处于持续激活状态, 导致信号过度活跃和基因转录失控。JAK 激酶通过跨膜受体被激活, 负责磷酸化 STATs。JAK 的功能获得性突变与血液系统恶性肿瘤如血小板增多症、骨髓纤维化和白血病的发生相关。

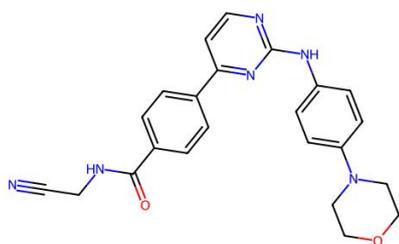


图 1 CYT-387 化学结构式

## 阿拉丁 JAK 信号通路抑制剂：

AZD-1480 [A126326](#)

白皮杉醇 [P108001](#)、[P580488](#)

BMS-911543 [B421120](#)、[B345013](#)

费德拉替尼 [T126330](#)、[F408078](#)

CYT-387 [C127224](#)、[M408149](#)

枸橼酸托法替尼 [E129454](#)、[T408126](#)

非戈替尼 [F420902](#)、[F413789](#)

酪氨酸激酶抑制剂 AG 490 [A126525](#)

鲁索替尼 [R126338](#)、[R409244](#)

WHI-P131(JANEX-1) [J422462](#)、[J126663](#)

JAK2 抑制剂 V [J422387](#)、[J339604](#)

## 阿拉丁 STAT 信号通路抑制剂：

卡铂 [C423884](#)、[C110682](#)、[C295384](#)

芝麻素 [S107347](#)、[S425032](#)、[S171302](#)

科罗素酸 [D135631](#)、[C580352](#)

索拉非尼 [S125098](#)、[S408543](#)

隐丹参酮 [C101974](#)、[C101973](#)、[C408350](#)

萝卜硫素 [D424040](#)、[S140384](#)、[S111997](#)

脱甲氧基姜黄素 [D133747](#)、[D580368](#)

丹参酮 IIA [T109795](#)、[T109794](#)、[T424804](#)

3-没食子酸酯 [E107403](#)、[E107404](#)、

[E409009](#)

## 参考文献

1. Yu H, Pardoll D, Jove R. Nat Rev Cancer. 2009 Nov;9(11):798-809.
2. Berger A, Sexl V, Valent P, et al. Oncotarget. 2014 Oct 30;5(20):9564-76.
3. Vainchenker W, Constantinescu SN. Oncogene. 2013 May 23;32(21):2601-13.

阿拉丁：<https://www.aladdin-e.com/>