

Catalog Number: CM00766

产品信息

Catalog Number:
CM00766

CAS号:
274693-27-5

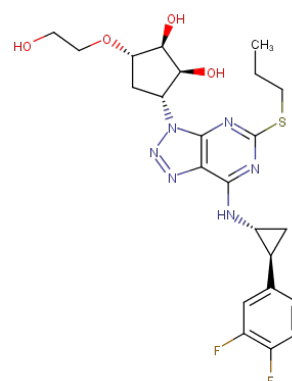
分子式:
 $C_{23}H_{28}F_2N_6O_4S$

主要靶点:
P450|P2Y Receptor

主要通路:
代谢|神经科学|G 蛋白偶联受体

分子量:
522.57

溶解度:
5% DMSO+40 % PEG300+5 %
Tween 80+50 % Saline:5 mg/mL
(9.57 mM);DMSO:50 mg/mL
(95.68 mM)



靶点活性

P2Y12:2 nM(Ki)

体外活性

Ticagrelor的 $t_{1/2}$ 大约为7-8.5小时.Ticagrelor与血小板聚集的抑制剂量有关,以100-400 mg处理2小时可完全抑制.Ticagrelor有良好的耐受性,既无严重的不良事件,也无明显的实验值变化.Ticagrelor吸收快,1.3-2小时即可达峰.在所研究的剂量范围内,Ticagrelor峰值浓度和药时曲线下面积(从时间0到无穷大的)以明显的剂量比例增加,表明其线性药物动力学特征.

体内活性

在对rh-P2Y12受体转染的CHO-K1进行结合研究中,Ticagrelor表现出高效可逆的结合, K_{on} (结合常数)为0.00011/(nM·s), K_d 为10.5 nM, k_{off} (解离常数)为0.00087/s,结合与解离半衰期值分别为4分钟和14分钟,表明可结合血小板的药物浓度决定了血小板的抑制大小。Ticagrelor是不需要代谢活化的活性药物。Ticagrelor不与ADP在ADP结合位点直接竞争,但会占据邻近的结合位点,改变结合位点构象导致一个可逆的受体的构象变化。Ticagrelor与受体结合是可逆的,快速起/失效。

储存

keep away from moisture | Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.