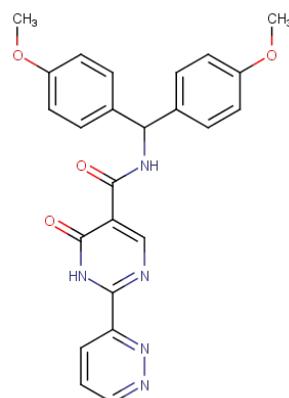


**Catalog Number:** CM04470**产品信息****Catalog Number:** CM04470**CAS号:** 1187990-87-9**分子式:** C<sub>24</sub>H<sub>21</sub>N<sub>5</sub>O<sub>4</sub>**主要靶点:** HIF/HIF Prolyl-Hydroxylase**主要通路:** 表观遗传|代谢**分子量:**

443.45

**溶解度:**

DMSO:1 mg/mL (2.26 mM)

**靶点活性**

PHD1:1 nM|PHD3:14 nM|PHD2:1 nM

**体外活性**

在体外实验中, MK-8617对CYP1A2、3A4、2B6、2C9、2C19及2D6的抑制作用不明显 (IC<sub>50</sub>>60 μM), 而作为CYP2C8的中等强度可逆抑制剂 (IC<sub>50</sub>: 1.6 μM)。MK-8617 (10 μM) 在对171种放射性配体结合和酶类测定的通用面板中表现为无活性。

**体内活性**

在大鼠、狗和猴的肝微粒体中(+NADPH), 标记的MK-8617显示出极低的代谢转换率(<10%), 但在HLMs中, 在60分钟后(10 μM化合物, 1 mg/mL微粒体蛋白)出现显著的代谢转换率(34%)。MK-8617在不同物种中具有良好的口服生物利用度(3671%), 具有低清除率和低分布体积。在挑战后3天5和15 mg/kg剂量以及挑战后4天15 mg/kg剂量时, 观察到循环网织红细胞的增加。

**储存**

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