

Catalog Number: CM04470

## 产品信息

**Catalog Number:**  
CM04470

**CAS号:**  
1187990-87-9

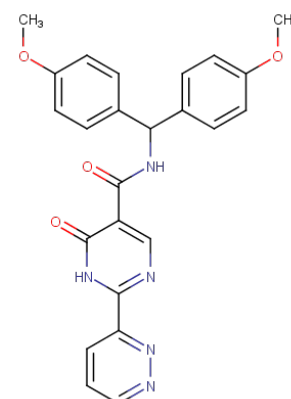
**分子式:**  
C<sub>24</sub>H<sub>21</sub>N<sub>5</sub>O<sub>4</sub>

**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.