

Catalog Number: CM11151

产品信息

Catalog Number:
CM11151

CAS号:
1858206-76-4

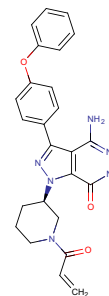
分子式:
C₂₅H₂₄N₆O₃

主要靶点:
BTK

主要通路:
蛋白酪氨酸激酶|血管生成

分子量:
456.5

溶解度:
DMSO:100 mg/mL (219.06 mM)



靶点活性

BTK:2.1 nM

体外活性

BTK inhibitor 17 对BTK激酶具有高效活性，且具备可接受的药代动力学特性。BTK inhibitor 17 能与Cys481共价结合，并与门控残基Thr474、铰链关键残基Met477和Glu475形成HB网络[1]。

体内活性

BTK inhibitor 17 在小鼠胶原诱导性关节炎(CIA)模型中展现了显著的体内功效。在人类、大鼠和小鼠三个物种中，BTK inhibitor 17 显示出高于95%的血浆蛋白结合率。经静脉注射后，观测到两个物种的半衰期（大鼠0.32小时；小鼠0.42小时）、清除率（大鼠54.6 mL/min/kg；小鼠31.3 mL/min/kg）、分布体积（大鼠1.55 L/kg；小鼠0.82 L/kg）及AUC暴露（大鼠604 ng.h/mL；小鼠576 ng.h/mL）。口服给药后，BTK inhibitor 17 在两个物种中显示更高的Cmax（大鼠466 ng/mL；小鼠252 ng/mL）和血浆暴露度（大鼠642 ng.h/mL；小鼠128 ng.h/mL），具有较好的口服生物利用度（大鼠23.7%；小鼠11.2%）[1]。在注射胶原蛋白的雄性Balb/C小鼠中，BTK inhibitor 17 抑制了疾病的显著进展，并展现了明确的剂量依赖性减少平均每爪临床评分[1]。

储存

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