

产品名称: UK 383367

产品别名: UK 383367

生物活性:

Description	UK 383367 是 procollagen C-proteinase (前胶原 C 端蛋白酶) 抑制剂, IC50 为 44 nM, 对 MMPs 具有优异的选择性。																								
IC ₅₀ & Target	Procollagen C proteinase [1] 44 nM																								
In Vitro	UK-383367 有效穿透人体皮肤。[1]UK-383367 抑制胶原沉积, IC50 为~2 μM。UK-383367 对所有 PDE-4 亚型具有适度的亲和力, 作用于 PDE-4a, PDE-4b, PDE-4c 和 PDE-4d, IC50 分别为 1.8 μM, 1.5 μM, 2.4 μM 和 0.9 μM。[2]UK-383367 是一种弱酸性化合物, 具有亲脂性。[3]																								
In Vivo	UK-383367 作用于大鼠, 狗和人的血浆蛋白结合值分别为 95%, 93% 和 94%。UK-383367 在大鼠血浆中温育, 半衰期为 49 分钟。UK-383367 按 2 mg/kg 剂量单独静脉给药处理大鼠, 血浆清除率为 157 mL min-1 kg-1, 分布容积为 12 L kg-1, 消除半衰期为 0.8 小时。UK-383367 按 0.5 mg/kg 剂量单独静脉给药处理狗, 血浆清除率为 35 mL min-1 kg-1, 分布容积为 4.6 L kg-1, 消除半衰期为 1.5 小时。UK-383367 按 2 mg/kg 剂量口服处理给药狗, Cmax 为 110 ng/mL, Tmax 为 0.5-1.5 小时, 口服生物有效性为 13%。[3]																								
Solvent&Solubility	<p>In Vitro: DMSO : 65 mg/mL (200.38 mM) Ethanol: 65 mg/mL (200.38 mM) Water: 65 mg/mL (200.38 mM)</p> <table border="1"><thead><tr><th rowspan="2">Preparing Stock Solutions</th><th>Solvent / Mass Concentration</th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th></tr></thead><tbody><tr><td>1 mM</td><td>3.0828 mL</td><td>15.4140 mL</td><td>30.8280 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.6166 mL</td><td>3.0828 mL</td><td>6.1656 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.3083 mL</td><td>1.5414 mL</td><td>3.0828 mL</td></tr><tr><td>50 mM</td><td>0.0617 mL</td><td>0.3083 mL</td><td>0.6166 mL</td></tr></tbody></table> <p>*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液, 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限 -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。</p>				Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	3.0828 mL	15.4140 mL	30.8280 mL	5 mM	0.6166 mL	3.0828 mL	6.1656 mL	10 mM	0.3083 mL	1.5414 mL	3.0828 mL	50 mM	0.0617 mL	0.3083 mL	0.6166 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg																					
	1 mM	3.0828 mL	15.4140 mL	30.8280 mL																					
5 mM	0.6166 mL	3.0828 mL	6.1656 mL																						
10 mM	0.3083 mL	1.5414 mL	3.0828 mL																						
50 mM	0.0617 mL	0.3083 mL	0.6166 mL																						
References	<p>[1] Fish PV, et al. J Med Chem, 2007, 50(15), 3442-3456. [2] Bailey S, et al. Bioorg Med Chem Lett, 2008, 18(24), 6562-6567. [3] Allan GA, et al. Xenobiotica, 2006, 36(5), 399-418.</p>																								
实验参考:																									
Animal Administration	<p>动物实验: [3] Animal Models: Sprague-Dawley 大鼠 Formulation: 15% w/v 羟丙基-β-环糊精 Dosages: 2 mg/kg Administration: 静脉处理</p>																								
References	<p>[1] Fish PV, et al. J Med Chem, 2007, 50(15), 3442-3456. [2] Bailey S, et al. Bioorg Med Chem Lett, 2008, 18(24), 6562-6567. [3] Allan GA, et al. Xenobiotica, 2006, 36(5), 399-418.</p>																								