

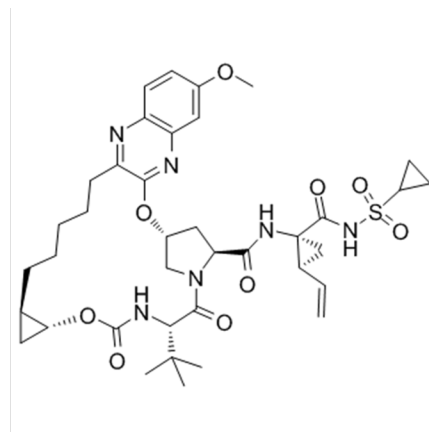
## MK5172 (HCV抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC3260-10mM	MK5172 (HCV抑制剂)	10mM×0.2ml
SC3260-5mg	MK5172 (HCV抑制剂)	5mg
SC3260-25mg	MK5172 (HCV抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	(1R,2S)-N-[[[(1R,2R)-2-[5-(3-Hydroxy-6-methoxy-2-quinoxaliny)pentyl]cyclopropyl]oxy]carbonyl]-3-methyl-L-valyl-(4R)-4-hydroxy-L-prolyl-1-amino-N-(cyclopropylsulfonyl)-2-ethenylcyclopropanecarboxamide cyclic (1→;2)-ether
简称	MK5172
别名	Grazoprevir, MK 5172, MK5172
中文名	N/A
化学式	C <sub>38</sub> H <sub>50</sub> N <sub>6</sub> O <sub>9</sub> S
分子量	766.9
CAS号	1350514-68-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 10mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.65ml DMSO, 或每7.67mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC3260-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	MK-5172 is a novel P2-P4 quinoxaline macrocyclic HCV NS3/4a protease inhibitor currently in clinical development.			
信号通路	Anti-infection; Metabolism; Proteases			
靶点	genotype 1b	genotype 1a	—	—
IC50	7.4nM	7nM	—	—
体外研究	In biochemical assays, MK-5172 was effective against a panel of major genotypes and variants engineered with common resistant mutations observed in clinical studies with other NS3/4a protease inhibitors. In the replicon assay, MK-5172 demonstrated subnanomolar to low-nanomolar EC50s against genotypes 1a, 1b, and 2a.			
体内研究	In rats, MK-5172 showed a plasma clearance of 28ml/min/kg and plasma half-life of 1.4hr. When dosed p.o. at 5mg/kg, the plasma exposure of MK-5172 was good with an AUC of 0.7μM.hr. The liver exposure of the compound was quite good (23μM at 4hr), and MK-5172 remained in liver 24hr after a single p.o. 5mg/kg dose. At 24hr, the liver concentration of MK-5172 was 0.2μM, which was over 25-fold higher than the IC50 in the replicon assay with 50% NHS. When dosed to dogs, MK-5172 showed low clearance of 5ml/min/kg and a 3hr half-life after i.v. 2mg/kg dosing and had good plasma exposure (AUC=0.4μM.hr) after a p.o. 1mg/kg dose.			
临床实验	Evaluation of Hepatic Pharmacokinetics for MK-5172 in Participants With Chronic Hepatitis C. Phase 1.			
特征	N/A			

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A

方法	N/A
----	-----

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

1. Steven Harper, John A. McCauley, Michael T. ACS Med. Chem. Lett. 2012, 3(4), 332-336.
2. Summa V, Ludmerer SW, McCauley JA. Antimicrob Agents Chemother. 2012 Aug, 56(8), 4161-7.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC3260-10mM	MK5172 (HCV抑制剂)	10mM×0.2ml
SC3260-5mg	MK5172 (HCV抑制剂)	5mg
SC3260-25mg	MK5172 (HCV抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01