

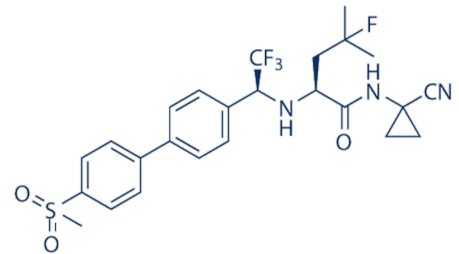
Odanacatib (Cysteine Protease抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF4184-10mM	Odanacatib (Cysteine Protease抑制剂)	10mM×0.2ml
SF4184-5mg	Odanacatib (Cysteine Protease抑制剂)	5mg
SF4184-25mg	Odanacatib (Cysteine Protease抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(2S)-N-(1-cyanocyclopropyl)-4-fluoro-4-methyl-2-[[[(1S)-2,2,2-trifluoro-1-[4-(4-methylsulfonylphenyl)phenyl]ethyl]amino]pentanamide
简称	Odanacatib
别名	MK-0822, MK 0822, UNII-N673F6W2VH, ChEMBL481611
中文名	N/A
化学式	C ₂₅ H ₂₇ F ₄ N ₃ O ₃ S
分子量	525.56
CAS号	603139-19-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.95ml DMSO, 或每5.26mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF4184-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Odanacatib (MK-0822)是一种有效的, 选择性的, cathepsin K(人/兔)中性抑制剂, IC ₅₀ 为0.2nM/1nM, 对脱靶的cathepsin B、L、S具有高度选择性。Phase 3。				
信号通路	Proteases				
靶点	Cathepsin K (human)	Cathepsin K (rabbit)	—	—	—
IC ₅₀	0.2nM	1nM	—	—	—
体外研究	在体外, Odanacatib作用于组织蛋白酶 K具有高抑制活性和选择性, 作用于人和兔组织蛋白酶K时, IC ₅₀ 分别为0.2nM和1nM。而且, 在全部人细胞酶实验中, Odanacatib也同样有效, IC ₅₀ 为5nM。最新研究显示, Odanacatib通过阻断细胞内囊泡运输而导致Osteoclast(OC)再吸收活性降低。				
体内研究	Odanacatib按10mg/kg剂量作用于临床前期大鼠, 具有良好的药动力学特性, 如清除能力(CI: 2ml/kg·min)、低量分布(V _{dss} : 1.1L/kg)、半衰期(T _{1/2} : 6小时), 及口服生物有效性(F: 8%)。此外, Odanacatib作用于肝脏恢复96%的亲本大鼠, 也具有良好的代谢稳定性。Odanacatib(ODN)口服处理切除卵巢(OVX)的兔子, 也阻止骨质流失, 这种作用存在剂量依赖性。而且, Odanacatib每天按9μM处理, 显著提高股骨近端骨密度(BMD)(7.8%)、股骨颈BMD(10.8%)及大腿大转子BMD(6.5%)。Odanacatib长期处理缺乏雌激素, 骨骼成熟的猕猴, 高效抑制骨代谢, 不会降低破骨细胞数量, 且维持卵巢切除(OVX)非人灵长类动物脊柱的正常生物力学特性。				
临床实验	N/A				
特征	Odanacatib是有效的组织蛋白酶K选择性中性抑制剂。				

➤ 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	为了测定酶活性, 在含2.5mM DTT, 2.5mM EDTA和10% DMSO的50mM MES pH 5.5中进行实验。使用2μM Z-Leu-Arg-AMC作为底物, 测定Odanacatib作用于人组织蛋白酶 K和人性化兔子组织蛋白酶K的IC ₅₀ 值。加入底物之前, 不同浓度抑制剂Odanacatib (100μM到0.2nM)与每组酶(0.2nM-1nM)预温育15分钟, 建立酶-抑制剂复合物。然后加入底物, 在460nm (λ _{ex} =355nm)处测定提高的荧光值而测量酶活性。终反应体积为100μl。实验在96孔板上进行, 然后使用Spectramax酶标仪读数。根据对照组计算实验组抑

	制百分数。测定IC50值。
--	---------------

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	切除卵巢的(OVX)兔模型
配制	Odanacatib is provided in a diet formulae.
剂量	≤9μM/day
给药方式	口服处理

➤ **参考文献:**

- 1.Gauthier JY, et al. Bioorg Med Chem Lett. 2008, 18(3), 923-928.
- 2.Leung P, et al. Bone. 2011, 49(4), 623-635.
- 3.Pennypacker BL, et al. J Bone Miner Res. 2011, 26(2), 252-262.
- 4.Masarachia PJ, et al. J Bone Miner Res. 2012, 27(3), 509-523.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF4184-10mM	Odanacatib (Cysteine Protease抑制剂)	10mM×0.2ml
SF4184-5mg	Odanacatib (Cysteine Protease抑制剂)	5mg
SF4184-25mg	Odanacatib (Cysteine Protease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