

VX-765

Catalog No: RM02817

基本信息

货号

RM02817

CAS No.

273404-37-8

分子式

C₂₄H₃₃ClN₄O₆

分子量

508.99

靶点

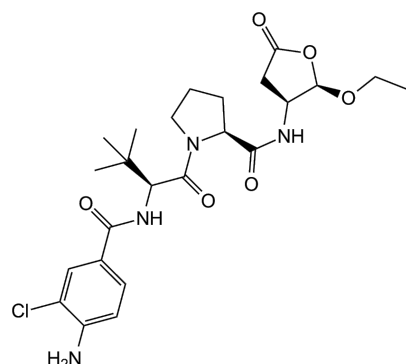
Caspase

信号通路

Pyroptosis(焦亡)

保存条件

Desiccate at -20°C



溶解性数据

		≥313 mg/mL in DMSO, 50.5 mg/mL in EtOH with ultrasonic, insoluble in H2O				
体外实验	制备贮备液	质量		1 mg	5 mg	10 mg
		溶剂				
		浓度				
		1 mM	1.9647 mL	9.8234 mL	19.6468 mL	
		5 mM	0.3929 mL	1.9647 mL	3.9294 mL	
		10 mM	0.1965 mL	0.9823 mL	1.9647 mL	
请参考溶解度信息选择适当的溶剂						

实验操作

动物实验

动物模型	胶原诱导性关节炎 (CIA) 小鼠模型
剂量	10, 25, 50或100 mg/kg, 口服给药, 每日2次, 持续24天
应用	在CIA小鼠模型中, VX-765显著地呈剂量依赖性地减少炎症分数。此外, 100 mg/kg VX-765与5 mg/kg Prednisolone具有相同的效果。
注意事项	请于室内测试所有化合物的溶解度。虽然化合物的实际溶解度可能与其理论值略有不同, 但仍处于实验系统误差的允许范围内。

激酶实验

蛋白酶试验	通过测定底物水解速率评估酶抑制程度。使用对硝基苯胺或氨基苯基香豆素 (AMC) 标记的底物, 如: ICE/caspase-1, suc-YVAD-对硝基苯胺; caspase-4, Ac-WEHD-AMC; caspase-6, Ac-VEID-AMC; caspase-3, caspase-7, caspase-8, 和caspase-9, Ac-DEVD-AMC; 颗粒酶B, Ac-IEPD-AMC。将酶和底物加入到反应缓冲液中 [10 mM Tris, pH 7.5, 0.1% (w/v) CHAPS, 1 mM 二硫苏糖醇以及5% (v/v) 二甲基亚砜], 置于37 °C下孵育10分钟。将甘油8% (v/v)加入caspase-3, caspase-6, caspase-9 和颗粒酶B的缓冲液中, 以提高酶的稳定性。使用荧光计测定底物水解速率。
-------	---

参考文献

[1]. Wannamaker W, Davies R, Namchuk M, Pollard J, Ford P, Ku G, et al. (S)-1-((S)-2-[[1-(4-amino-3-chloro-phenyl)-methanoyl]-amino]-3,3-dimethyl-butanoyl)-pyrrolidine-2-carboxylic acid ((2R,3S)-2-ethoxy-5-oxo-tetrahydro-furan-3-yl)-amide (VX-765), an orally available selective interleukin (IL)-1 converting enzyme/caspase-1 inhibitor, exhibits potent anti-inflammatory activities by inhibiting the release of IL-1β and IL-18. J Pharmacol Exp Ther 2007;321:509-516.

Contact

 | 400-999-6126

 | cn.market@abclonal.com.cn
 | www.abclonal.com.cn