

产品名称: **Omarigliptin**

产品别名: **MK-3102**

生物活性:

Description	Omarigliptin (MK-3102)是一种竞争性的、可逆的 DPP-4 抑制剂(IC ₅₀ = 1.6 nM, K _i = 0.8 nM)。在所有检测的蛋白酶中, 包括 QPP, FAP, PEP, DPP8 和 DPP9 等, 对 DPP-4 具有高选择性, 具有微弱的离子通道活性 (IC ₅₀ > 30 μM at IKr, Ca γ 1.2, and Na γ 1.5)。			
IC₅₀ & Target	DPP-4 [1] (Cell-free assay)			
	1.6 nM			
In Vitro	Omarigliptin 是一种有效的 DPP-4 抑制剂, 在其他所检测蛋白酶中, 具有高选择性(IC ₅₀ > 67 μmol/L), 并具有微弱的离子通道活性, 对 IKr, Ca γ 1.2, and Na γ 1.5 的 IC ₅₀ 值大于 30 μM。Omarigliptin 快速地、竞争性地与 DPP-4 活性位点结合, 这一过程具有高度选择性, 是一个可逆的过程, 在血糖过高的情况下, Omarigliptin 可导致胰岛素水平的升高和胰高血糖素水平的降低[2]。			
In Vivo	在瘦鼠的口服葡萄糖耐量试验(OGTT)中, 葡萄糖筛选前 1 小时, 口服 Omarigliptin 能显著地、浓度依赖性地降低血糖波动。omarigliptin 的给药浓度依赖性地增加活性 GLP-1 的血药浓度。它在雄性 Sprague-Dawley 大鼠和小猎犬中的药代动力学研究显示, omarigliptin 具有低清除率 (0.9-1.1 mL/min/kg); 在稳态下分布容积为 0.8-1.3 L/kg; 终末半衰期长, 约为 11-22 h。在犬类和大鼠中, omarigliptin 的口服生物利用度高, 近乎 100%。在研究期间, omarigliptin 耐受良好, 没有观测到死亡率或生理指标的明显变化[1]。在受试者单次口服 25 mg 的 omarigliptin 后, omarigliptin 在体内迅速被吸收, 在 1 小时内达到峰浓度(C _{max})750 nmol/L。在受试者中, 生物利用度 ≥ 74 % [2]。			
Solvent&Solubility	<i>In Vitro:</i> DMSO : 50 mg/mL (125.49 mM; Need ultrasonic)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	
		Concentration		
			1 mg	5 mg
				10 mg
		1 mM	2.5099 mL	12.5493 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.5020 mL	2.5099 mL
		10 mM	0.2510 mL	1.2549 mL
		50 mM	0.0502 mL	0.2510 mL
	*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。			
References	[1] Biftu T, et al. J Med Chem. 2014, 57(8):3205-12. [2] Burness CB, et al. Drugs. 2015, 75(16):1947-52.			