

产品名称: **TAK-438**
 产品别名: **Vonoprazan Fumarate**

生物活性:					
Description	Vonoprazan Fumarate (TAK-438)是一种新型 P-CAB (钾离子竞争性酸抑制剂),可逆抑制 H⁺/K⁺, ATPase , IC50 为 19 nM (pH 6.5), 控制胃酸分泌。Phase 3。				
IC ₅₀ & Target	H ⁺ /K ⁺ -ATPase [1]				
	19 nM				
In Vitro	TAK-438 是一种吡咯类衍生物, 具有与 P-CABs 完全不同的化学结构。TAK-438 抑制胃部 H ⁺ , K ⁺ -ATPase 活性, 这种作用存在浓度依赖性。在中性条件下 (pH7.5), TAK-438 的抑制活性与在弱酸性条件下 (pH 为 6.5) 几乎相同。TAK-438 不抑制 Na ⁺ , K ⁺ -ATPase 活性, 即使浓度高于其作用于胃部 H ⁺ , K ⁺ -ATPase 活性的 IC50 值 500 倍。TAK-438 抑制胃部 H ⁺ , K ⁺ -ATPase 活性, 按 K ⁺ 竞争性的方式, Ki 为 3 nM。[2]				
In Vivo	TAK-438 抑制基础胃酸分泌, 这种作用存在剂量依赖性, ID50 值为 1.26 mg/kg。TAK-438 静脉给药, 增加胃部灌注液的 pH 值, 这种作用存在剂量依赖性, 增加的 pH 值在给药后维持 5 小时。TAK-438 按 1 mg/kg 剂量处理, 90 分钟后, pH 值达到稳定状态, 最高 pH 值为 5.9。[2] 此外, TAK-438 处理大鼠和狗, 有效且更持久地抑制组胺刺激的胃酸分泌。TAK-438 通过胃组织的高积累和低清除力, 具有显著的抗分泌活性。TAK-438 不受胃液分泌状态影响, 不像 PPIs。[3]				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : 62 mg/mL (134.36 mM) Water: Insoluble Ethanol: Insoluble				
	<div>Preparing Stock Solutions</div>	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1670 mL	10.8352 mL	21.6704 mL
		5 mM	0.4334 mL	2.1670 mL	4.3341 mL
		10 mM	0.2167 mL	1.0835 mL	2.1670 mL
		50 mM	0.0433 mL	0.2167 mL	0.4334 mL
	<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。</p> <p>储备液的保存方式和期限: -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。-80℃ 储存时, 请在 6 个月内使用, -20℃ 储存时, 请在 1 个月内使用。</p>				
References	<p>[1] Arikawa Y, et al. J Med Chem, 2012, 55(9), 4446-4456.</p> <p>[2] Hori Y, et al. J Pharmacol Exp Ther, 2010, 335(1), 231-238.</p> <p>[3] Hori Y, et al. J Pharmacol Exp Ther, 2011, 337(3), 797-804.</p>				
实验参考:					
Animal Administration	<p>动物实验: [3]</p> <p>Animal Models: 雄性 Sprague-Dawley 大鼠</p> <p>Formulation: 0.5% 甲基纤维素溶液</p> <p>Dosages: 1, 2, 和 4 mg/kg</p> <p>Administration: 口服处理</p>				
References	<p>[1] Arikawa Y, et al. J Med Chem, 2012, 55(9), 4446-4456.</p> <p>[2] Hori Y, et al. J Pharmacol Exp Ther, 2010, 335(1), 231-238.</p>				



源叶生物