

Catalog Number: CM00254

产品信息

Catalog Number:
CM00254

CAS号:
144060-53-7

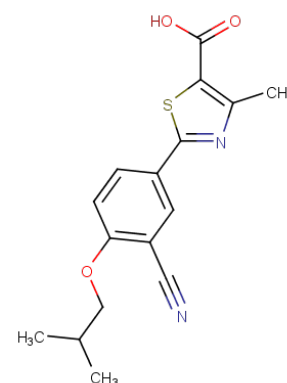
分子式:
C₁₆H₁₆N₂O₃S

主要靶点:
Xanthine Oxidase|ROS

主要通路:
代谢|免疫与炎症

分子量:
316.37

溶解度:
Ethanol:15.8 mg/mL (50
mM),DMSO:23.7 mg/mL (75 mM)



靶点活性

xanthine oxidase:0.6 nM(Ki)

体外活性

与单独的左旋糖相比, Febuxostat (5–6 mg/kg/day) 结合左旋糖使大鼠体内尿酸, 血压, 胰岛素以及甘油三酯显著降低; Febuxostat (5–6 mg/kg/day) 结合左旋糖也会减少肾血管收缩, 降低大鼠体内肾小球压和入球小动脉区域. 在5/6肾切除 (5/6 Nx) + 氧嗪酸(OA) + Febuxostat(Fx) 处理的大鼠体内, Febuxostat能够防止高尿酸血症发生, 改善尿蛋白情况, 保护肾功能, 还能防止5/6肾切除(5/6 Nx) + 载体 (V) / 氧嗪酸(OA) + Febuxostat(Fx) 大鼠肾小球性高血压, 横纹肌收缩(TAC)后, Febuxostat (5 mg/kg/day, 强饲8天) 治疗减弱TAC诱导的左心室(LV) 肥厚和功能障碍. 它还能减弱TAC诱导的硝基酪氨酸(指示减少心肌的氧化应激), p-mTOR(Ser2488) 以及 p-Erk(Thr202/Tyr204) 的增加, 而不影响总TOR或总Erk. 由对硝基酪氨酸, 尿8-异前列素和硫代巴比妥酸反应物的评估得出, Febuxostat使氧嗪酸活性受到显著抑制, 从而降低了右肾切除左侧肾脏I/R损害的Sprague-Dawley大鼠体内的氧化应激. 从ATF4, GRP-78以及CHOP评估得出, 在右肾切除左侧肾脏I/R损害的SD大鼠体内, Febuxostat也会内质网应激的诱发降低.

体内活性

Febuxostat能抑制混合型纯化的牛乳黄嘌呤氧化酶活性, Ki 和Ki' 值分别为0.6 nM和3.1 nM, 还能抑制还原型和氧化型黄嘌呤氧化酶。

描述

Febuxostat is a xanthine oxidase Inhibitor.

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 2 years