

starlight

Probes that illuminate your target

詳しくは裏面へ

Starlight社供給 薬物動態学における新ツール

## CYP3A5特異的基質

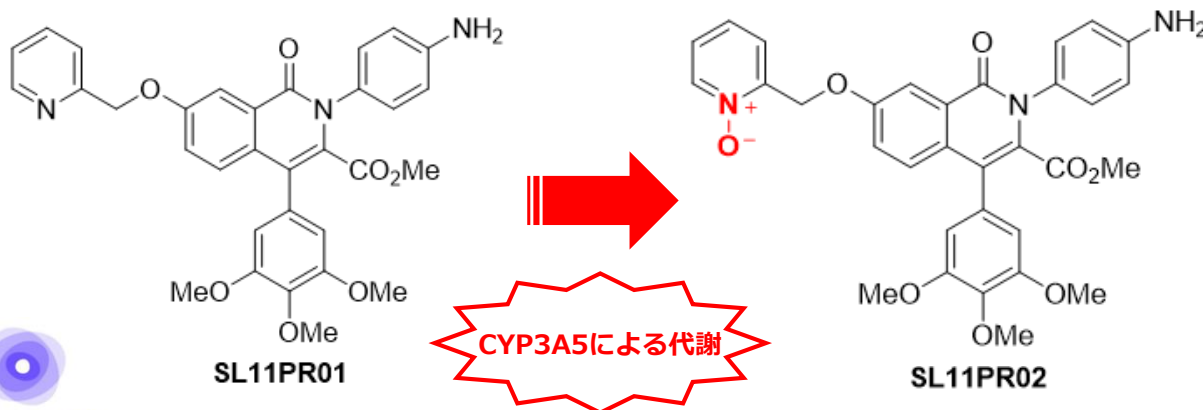
## CYP3A5活性の選択的な測定が可能

## 製品一覧

製品番号	製品名	容量	定価 (税別)	保存温度
SL11PR01-1MG	CYPPROB3A5 (Substrate 3A5 Parent) 化合物名: 2-(4-Aminophenyl)-1,2-dihydro-1-oxo-7-(2-pyridinylmethoxy)-4-(3,4,5-trimethoxyphenyl)-3-isoquinolinecarboxylic Acid Methyl Ester Dihydrochloride	1mg	78,000円	+4°C
SL11PR02-1MG	CYPPROB3A5 (Substrate 3A5 Metabolite) 化合物名: 2-(4-Aminophenyl)-1,2-dihydro-7-[(1-oxido-2-pyridinyl)methoxy]-1-oxo-4-(3,4,5-trimethoxyphenyl)-3-isoquinolinecarboxylic Acid methyl Ester Monohydrochloride	1mg	98,000円	
SL11PR03-1MG	CYPPROB3A5 (Substrate 3A5 Deuterated form Parent) 化合物名: (2H3)methyl 2-(4-aminophenyl)-1-oxo-7-[(pyridin-2-yl)methoxy]-4-(3,4,5-trimethoxyphenyl)-1,2-dihydroisoquinoline-3-carboxylate dihydrochloride	1mg	128,000円	
SL11PR04-1MG	CYPPROB3A5 (Substrate 3A5 Deuterated form Metabolite) 化合物名: 2-([2-(4-aminophenyl)-3-(2H3)methoxycarbonyl]-1-oxo-4-(3,4,5-trimethoxyphenyl)-1,2-dihydroisoquinolin-7-yl]oxy)methylpyridin-1-ium-1-olate hydrochloride	1mg	152,000円	

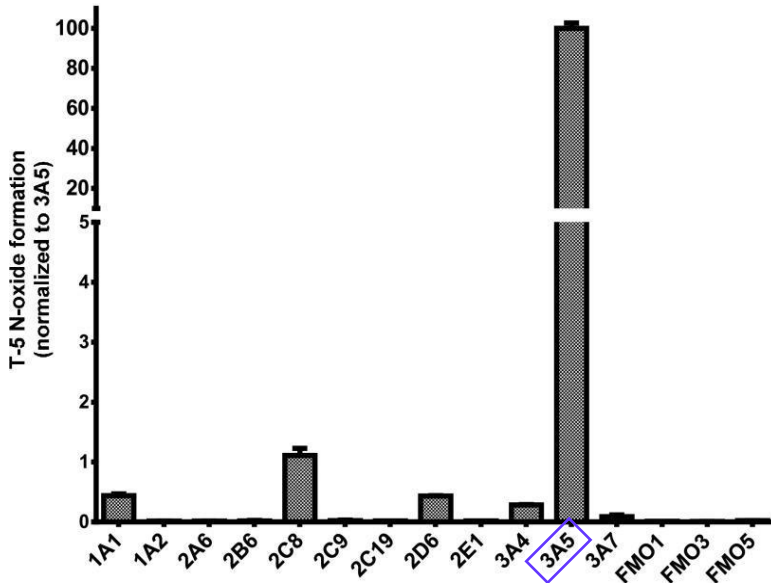
「SL11PR01」は、特異的基質としてCYP3A5によって代謝を受け、代謝物として「SL11PR02」が産生されます。これら2種を用いることで、CYP3A5活性の定量的評価が可能です。

「SL11PR03」と「SL11PR04」は、それぞれ「SL11PR01」と「SL11PR02」を重水素 (D) で標識した化合物です。



## 参考データ

下記のFigでは、SL11PR01を「T-5」、SL11PR02を「T-5 N-oxide」と表記しています。



Formation of T-5 N-oxide in recombinantly expressed enzymes. Twelve P450 and three FMO enzymes were compared. Incubations contained 5  $\mu\text{M}$  T-5 and 10 pmol/ml recombinant enzyme and were initiated with 1 mM NADPH. To minimize the potential for thermal inactivation, FMO incubations were initiated by the addition of FMO. (A) After 15 minutes, the incubation was stopped with an equal volume of ACN, and T-5 N-oxide formation was evaluated by LC-MS/MS.

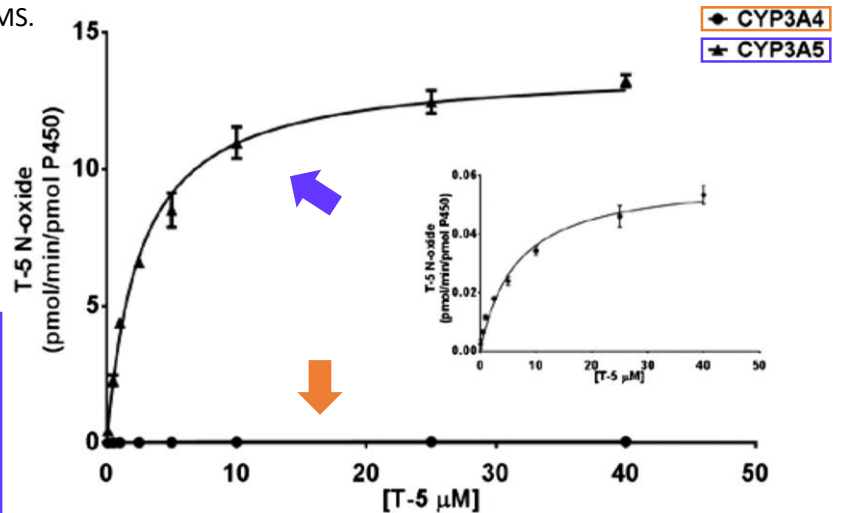
組換え薬物代謝酵素  
(12種のP450と3種のFMO)  
を用いた代謝試験結果

rCYP3A5による  
代謝物の形成が、  
その他分子種の

約**100倍!**

## 代謝試験結果の比較 rCYP3A4 vs rCYP3A5

rCYP3A4では代謝物の形成がほとんど認められない一方、rCYP3A5では基質濃度に依存して代謝物量が上昇しています



Kinetics of T-5 N-oxide formation. Multiple concentrations of T-5 (0.1–40  $\mu\text{M}$ ) were incubated with 10 pmol/ml recombinant CYP3A4 or CYP3A5 in the presence of 1 mM NADPH for 15 minutes. Incubations were stopped by the addition of an equal volume of ACN. Results were fit to the Michaelis-Menten equation. When plotted on the same scale, CYP3A4 results cannot be discerned from the x-axis and are presented as an insert to aid in evaluation of the data.

(参考文献)

Li *et al.*, Drug Metab Dispos. 2014 Mar; 42(3): 334–342.

お問い合わせは・・・



株式会社 ケーエーシー  
<https://www.kacnet.co.jp>

▶ 試薬営業グループ  
〒110-0005  
東京都台東区上野1丁目4-4藤井ビル3階  
TEL:03-5807-7162 FAX:03-5807-7163  
e-mail:shiyaku-info@kacnet.co.jp