

## KP-457

### 产品信息

| 产品名称   | 产品编号      | 规格   |
|--------|-----------|------|
| KP-457 | 53472ES08 | 5 mg |

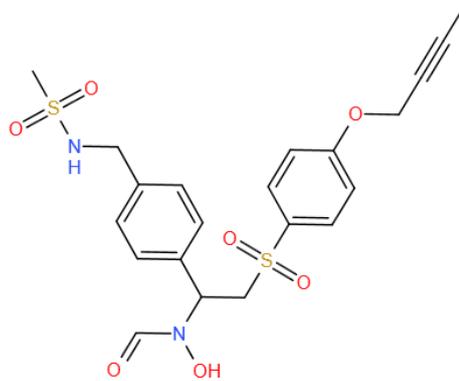
### 产品描述

KP-457 是一种选择性金属蛋白酶 17 抑制剂 (ADAM17 抑制剂), 对 ADAM17、ADAM10、MMP2 和 MMP13 的 IC<sub>50</sub> 值分别为 11.1 nM、748 nM、717 nM 和 930 nM。KP-457 可阻断 iPSC 血小板的 GPIb $\alpha$  脱落, 在 37°C 时可有效增强功能性 iPSC 衍生血小板的产生。

### 产品性质

|                        |  |
|------------------------|--|
| 英文别名 (English Synonym) | KP457; KP 457  |
| 中文名称 (Chinese Name)    | ADAM17 抑制剂   |
| 靶点 (Target)            | ADAM17; ADAM10; MMP2; MMP13  |
| 通路 (Pathway)           | Protease/Metabolic Enzyme--MMP   |
| CAS 号 (CAS NO.)        | 1365803-52-6   |
| 分子式 (Formula)          | C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> N <sub>2</sub> O <sub>7</sub> S <sub>2</sub> |
| 分子量 (Molecular Weight) | 480.55   |
| 外观 (Appearance)        | 粉末   |
| 纯度 (Purity)            | ≥98%   |
| 溶解性 (Solubility)       | 易溶于 DMSO   |

### 结构式 (Structure)



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 保持干燥, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

### 注意事项

- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
- 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

### 使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

## 使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

### 细胞实验（体外实验）

金属蛋白酶 17 抑制剂和可能的上游调节因子 p38 丝裂原活化蛋白激酶 (p38 MAPK) 抑制剂可以抑制 GPIb $\alpha$  脱落。KP-457 是金属蛋白酶 17 有效抑制剂，可阻断 iPSC 血小板的 GPIb $\alpha$  脱落，其抑制浓度低于全金属蛋白酶抑制剂 GM-6001 的半最大抑制浓度。在 KP-457 存在下产生的 iPSC 血小板表现出改善的 GPIb $\alpha$  依赖性聚集，不逊于人新鲜血小板。使用免疫缺陷小鼠输注血小板后血栓形成模型显示，KP-457 产生的 iPSC 血小板在体内发挥更好的止血功能。研究表明，与 GM-6001 或 p38 MAPK 抑制剂不同，KP-457 在 37°C 时可有效增强功能性人 iPSC 衍生血小板的产生。KP-457 可阻断 ADAM17 催化结构域的 Zn<sup>2+</sup> 螯合。KP-457 (15  $\mu$ M) 可保留 iPSC 衍生血小板上 GPIb $\alpha$  的表达。<sup>[1]</sup>

### 参考文献

[1]. Hirata S, et al. Selective Inhibition of ADAM17 Efficiently Mediates Glycoprotein Ib $\alpha$  Retention During Ex Vivo Generation of Human Induced Pluripotent Stem Cell-Derived Platelets. *Stem Cells Transl Med.* 2017 Mar;6(3):720-730.