

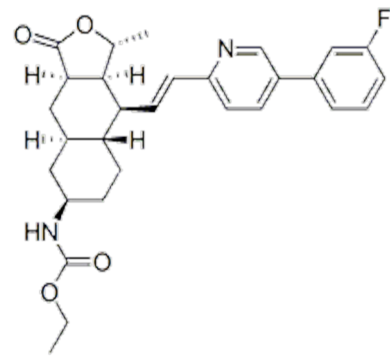
Vorapaxar (PAR-1拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD2416-10mM	Vorapaxar (PAR-1拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD2416-5mg	Vorapaxar (PAR-1拮抗剂)	5mg
SD2416-25mg	Vorapaxar (PAR-1拮抗剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	ethyl N-[(1R,3aR,4aR,6R,8aR,9S,9aS)-9-[(E)-2-[5-(3-fluorophenyl)pyridin-2-yl]ethenyl]-1-methyl-3-oxo-3a,4,4a,5,6,7,8,8a,9,9a-decahydro-1H-benzo[f][2]benzofuran-6-yl]carbamate
简称	Vorapaxar
别名	SCH 530348, SCH-530348, SCH530348, Zontivity
中文名	N/A
化学式	C ₂₉ H ₃₃ FN ₂ O ₄
分子量	492.58
CAS号	618385-01-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 99mg/ml; Ethanol 99mg/ml
溶液配制	5mg加入1.02ml DMSO, 或每4.93mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD2416-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Vorapaxar是一种口服有效的凝血酶受体(PAR-1)拮抗剂, Ki为8.1nM。				
信号通路	GPCR & G Protein				
靶点	PAR-1	—	—	—	—
IC50	8.1nM(Ki)	—	—	—	—
体外研究	SCH530348是一种合成的三环-3-苯基吡啶, 是口服有效的凝血酶受体拮抗剂。SCH530348有效抑制凝血酶诱导的血小板聚集, IC50为7nM, 也有效抑制haTRAP诱导的血小板聚集, IC50为25nM, 但是不抑制其他激动剂如ADP, 胶原蛋白和PAR-4激动剂肽诱导的血小板聚集。SCH530348对凝血酶原时间(PT), 部分凝血活酶时间(PTT), 或活化部分凝血活酶时间(aPTT)没有影响。而且, 与非活性对照组相比, SCH530348不会造成出血时间或手术出血增加。SCH530348作用于一些离子通道和受体, 包括PAR-4受体时, 选择性选择性作用于PAR-1。				
体内研究	SCH 530348分别按10mg/kg和1mg/kg剂量处理大鼠和猴, 吸收良好, 分别为68%和82%。处理大鼠和猴的Tmax分别为3小时和1小时, 消除半衰期分别为5.1小时和13小时, 口服生物利用度分别为33%和86%。在临床前期研究中, SCH 530348按超过0.1mg/kg的剂量口服处理食蟹猴血小板, 抑制100%凝血酶受体激动剂肽(TRAP)诱导的血小板聚集, 抑制达24小时, 在48小时有部分恢复发生。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	从40个单位的新鲜人血小板制备人血小板膜(700mg)。使用凝血酶受体放射性配体结合实验的一种改进法筛选凝血酶受体拮抗剂。在溶于结合缓冲液(50mM Tris-HCl, pH 7.5, 10mM MgCl ₂ , 1mM EGTA, 0.1% BSA)的浓度为1nM、3nM、30nM、100nM、300nM和1μM(DMSO终浓度为5%)的化合物, 存在时, 人血小板膜(40μg)与10nM [³ H] haTRAP(alanine-p-fluorophenylalaninearginine-cyclohexylalanine-homoarginine-[³ H]phenylalanine amide)温育。将实验板覆盖, 涡旋混合, 在摇床上室温下轻轻振荡1小时。使用Packard FilterMate通用收集器将温育膜收集到Packard UniFilter GF/C过滤板上, 过滤板在0.1%聚乙烯亚胺中浸泡至少1小时, 然后使用300μl不含BSA的冰冷却结合缓冲液迅速洗涤四次。每孔加入MicroScint 20闪烁液混

	合物，实验板置于Packard TopCount Microplate 闪烁计数器上计数。特异性结合定义为总结合减去非特异性结合(在过量(50 μ M)未标记haTRAP存在时观察到的)。
--	--

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	食蟹猕猴
配制	0.4%甲基纤维素
剂量	0.5, 0.3, 0.1和0.05mg/kg
给药方式	口服处理

➤ **参考文献:**

1.Chackalamannil S, et al. J Med Chem, 2008, 51(11), 3061-3064.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD2416-10mM	Vorapaxar (PAR-1拮抗剂)	10mM \times 0.2ml
SD2416-5mg	Vorapaxar (PAR-1拮抗剂)	5mg
SD2416-25mg	Vorapaxar (PAR-1拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01