

Vorapaxar ; 沃拉帕沙

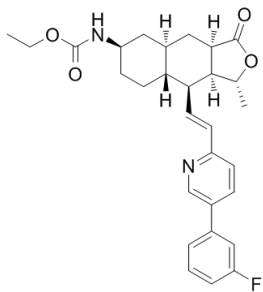
产品编号：MB0848

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG；25MG

产品形式：白色至类白色固体

基本信息

分子式	C ₂₉ H ₃₃ FN ₂ O ₄	结 构 式	
分子量	492.58		
CAS No.	618385-01-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 99 mg/mL (200.98 mM) Ethanol 99 mg/mL (200.98 mM) Water Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：沃拉帕沙 Vorapaxar 是凝血酶受体（蛋白酶活化受体，PAR-1）拮抗剂。

别名：Carbamic acid, N-[(1R,3aR,4aR,6R,8aR,9S,9aS)-9-[(1E)-2-[5-(3-fluorophenyl)-2-pyridinyl]ethenyl]dodecahydro-1-methyl-3-oxonaphtho[2,3-c]furan-6-yl]-, ethyl ester

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

UVλ_{max}：.....272, 306 nm

溶解性：.....DMSO 99 mg/mL (200.98 mM)；Ethanol 99 mg/mL (200.98 mM)；Water Insoluble

纯度：.....>98%,BR

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展

产品描述	Vorapaxar 是一种口服有效的凝血酶受体(PAR-1)拮抗剂，K _i 为 8.1 nM。		
靶点	<table border="1" style="width: 100%;"> <tr> <td>PAR-1 (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>8.1 nM(K_i)</td> </tr> </table>	PAR-1 (Cell-free assay)	8.1 nM(K _i)
PAR-1 (Cell-free assay)			
8.1 nM(K _i)			
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，IC ₅₀ 47 nM，也有效抑制 haTRAP 诱导的血小板聚集，IC ₅₀ 为 25 nM，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 10 mg/kg 和 1 mg/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 T _{max} 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 0.1 mg/kg 的剂量口服处理猕猴血小板，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。

美仑相关产品推荐

MB10261	[Phe1,Ser2,Tyr6]-人蛋白酶激活受体-1 (1-6)酰胺
MB11716	蛋白酶激活受体-1 (1-6), 人, 大鼠
MB11715	选择性蛋白酶激活受体-1 肽
MB11718	蛋白酶激活受体-2 (1-6), 小鼠, 大鼠
MB11722	蛋白酶激活受体-3 (1-6) 酰胺, 人
MB11723	蛋白酶激活受体-3 (1-6) 酰胺, 小鼠

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。Vorapaxar 是蛋白酶活化受体（PAR1; Ki = 8.1nM）的竞争性拮抗剂，也称为凝血酶受体。它对 PAR1 具有选择性而非其他 PAR，以及许多 GPCR，离子通道和受体。它抑制由凝血酶和 haTRAP（分别为 IC50 = 47 和 25nM）诱导的血小板聚集。Vorapaxar（0.1mg / kg，静脉内）完全抑制猕猴体内的血小板聚集。含有 vorapaxar 的制剂用于预防血栓性心血管疾病的相关治疗研究。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0301 mL	10.1506 mL	20.3013 mL
5 mM	0.4060 mL	2.0301 mL	4.0603 mL
10 mM	0.2030 mL	1.0151 mL	2.0301 mL
50 mM	0.0406 mL	0.2030 mL	0.4060 mL

经典实验操作（仅供参考）

动物实验	Animal Models: 食蟹猕猴 Formulation: 0.4%甲基纤维素 Dosages: 0.5, 0.3, 0.1, 和 0.05 mg/kg Administration: 口服处理
-------------	---

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。