

Catalog Number: CM05737

产品信息

Catalog Number:
CM05737

CAS号:
618385-01-6

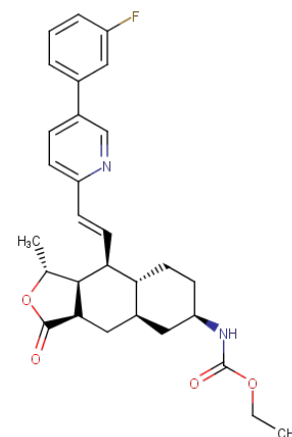
分子式:
C₂₉H₃₃FN₂O₄

主要靶点:
Protease-activated Receptor

主要通路:
G 蛋白偶联受体

分子量:
492.58

溶解度:
DMSO:92 mg/mL (186.77
mM);H₂O:< 1 mg/mL (insoluble
or slightly soluble);Ethanol:92
mg/mL (186.77 mM)



靶点活性

PAR1:8.1 nM(Ki)

体外活性

Vorapaxar 是一种合成的三环3-苯基吡啶，是一种口服活性的基于himbacine的血栓素受体拮抗剂。Vorapaxar 对血小板聚集的抑制作用强大，对由血栓素引起的血小板聚集具有47 nM的IC₅₀。对haTRAP引起的血小板聚集则有25 nM的IC₅₀。而对由ADP、胶原蛋白和PAR-4激动剂诱导的血小板聚集则无抑制作用。Vorapaxar 也不影响凝血酶原时间（PT）、部分凝血活酶时间（PTT）或活化的部分凝血活酶时间（aPTT），并且与无活性对照比较，不会增加出血时间或手术出血。在针对多种离子通道和受体的测试中，包括PAR-4受体，发现SCH530348对PAR-1选择性强。[1]

体内活性

Vorapaxar 在大鼠（68%；10 mg/kg）和猴子（82%；1 mg/kg）模型中吸收良好。大鼠的T_{max}大约在3小时，猴子的T_{max}在1小时。消除半衰期在大鼠为5.1小时，在猴子为13小时。口服生物利用度在大鼠为33%，在猴子为86%。在恒河猴血小板的临床前研究中，口服Vorapaxar，剂量超过0.1 mg/kg，可以在24小时内对血栓素受体激动肽（TRAP）诱导的血小板聚集实现100%的抑制，48小时时部分恢复。[1]

储存

store at low temperature | Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.