



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **Mavatrep**
产品别名: **JNJ-39439335**

生物活性:

Description

Mavatrep is an orally bioavailable TRPV1 antagonist ($K_i=6.5$ nM), exhibits minimal effect on the enzymatic activity ($IC_{50} > 25$ μ M) of CYP isoforms 3A4, 1A2, and 2D6. IC_{50} value: 6.5 nM (K_i , for TRPV1) Target: TRPV1 in vitro: Mavatrep exhibits superior pharmacodynamic properties. In a TRPV1 functional assay, using cells expressing recombinant human TRPV1 channels, Mavatrep antagonizes capsaicin-induced Ca^{2+} influx, with an IC_{50} value of 4.6 nM. Mavatrep blocks the activation of hTRPV1 channels by Capsaicin (1 μ M) and by pH (5.0) in a concentration-dependent fashion, with IC_{50} values of 23 and 6.8 nM, respectively. in vivo: Mavatrep exhibits superior pharmacodynamic properties in the CFA model of inflammatory pain.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : ≥ 28 mg/mL (66.28 mM)

H₂O : < 0.1 mg/mL (insoluble)

* " \geq " means soluble, but saturation unknown.

	Solvent	Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing		1 mM	2.3672 mL	11.8360 mL	23.6720 mL
Stock Solutions		5 mM	0.4734 mL	2.3672 mL	4.7344 mL
		10 mM	0.2367 mL	1.1836 mL	2.3672 mL

*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液;一旦配成溶液,请分装保存,避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限 -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时,请在 6 个月内使用, -20°C 储存时,请在 1 个月内使用。

In Vivo:

请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液,再依次添加助溶剂:

——为保证实验结果的可靠性,澄清的储备液可以根据储存条件,适当保存;体内实验的工作液,建议您现用现配,当天使用;以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比;如在配制过程中出现沉淀、析出现象,可以通过加热和/或超声的方式助溶

1.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.92 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.92 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例,取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中,混合均匀向上述体系中加入 50 μ L Tween-80,混合均匀;然后继续加入 450 μ L 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→ 90% (20% SBE- β -CD in saline)

Solubility: 2.5 mg/mL (5.92 mM); Suspended solution; Need ultrasonic

此方案可获得 2.5 mg/mL (5.92 mM)的均匀悬浊液,悬浊液可用于口服和腹腔注射。

以 1 mL 工作液为例,取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	盐水水溶液中，混合均匀。
References	[1]. Parsons WH, et al. Benzo[d]imidazole Transient Receptor Potential Vanilloid 1 Antagonists for the Treatment of Pain: Discovery of trans-2-(2-[2-(4-Trifluoromethyl-phenyl)-vinyl]-1H-benzimidazol-5-yl)-phenyl)-propan-2-ol (Mavatrep). J Med Chem. 2015 May



源叶生物