

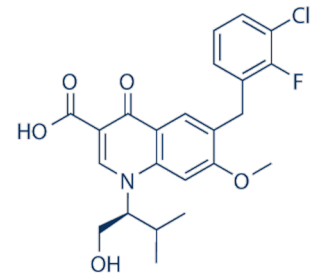
Elvitegravir (Integrase抑制剂)

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|-----------------------------|------------|
| SD8491-10mM | Elvitegravir (Integrase抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SD8491-5mg | Elvitegravir (Integrase抑制剂) | 5mg |
| SD8491-25mg | Elvitegravir (Integrase抑制剂) | 25mg |

产品简介:

➤ 化学信息:

| | |
|--------|--|
| 化学名 | 6-[(3-chloro-2-fluorophenyl)methyl]-1-[(2S)-1-hydroxy-3-methylbutan-2-yl]-7-methoxy-4-oxoquinoline-3-carboxylic acid |
| 简称 | Elvitegravir |
| 别名 | GS-9137, JTK-303, GS 9137, GS9137, JTK 303, JTK303, Vitekta |
| 中文名 | 埃替拉韦 |
| 化学式 | C ₂₃ H ₂₃ ClFNO ₅ |
| 分子量 | 447.88 |
| CAS号 | 697761-98-1 |
| 纯度 | 98% |
| 溶剂/溶解度 | Water <1mg/ml; DMSO 90mg/ml; Ethanol 35mg/ml |
| 溶液配制 | 5mg加入1.12ml DMSO, 或每4.48mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD8491-10mM用DMSO配制。 |



➤ 生物信息:

| | | | | | |
|------------------|---|-----------|-----------|---|---|
| 产品描述 | Elvitegravir (GS-9137, JTK-303)是一种HIV抑制剂, 作用于HIV-1 IIIB、HIV-2 EHO和HIV-2 ROD, 无细胞试验中IC ₅₀ 分别为0.7、2.8和1.4nM。 | | | | |
| 信号通路 | Microbiology | | | | |
| 靶点 | HIV-1 IIIB | HIV-2 ROD | HIV-2 EHO | — | — |
| IC ₅₀ | 0.7nM | 1.4nM | 2.8nM | — | — |
| 体外研究 | Elvitegravir抑制整合酶活性, IC ₅₀ 为6nM。Elvitegravir抑制PBMC和PA, IC ₅₀ 分别为0.89和20nM。Elvitegravir通过抑制DNA链转移而抑制HIV-1 cDNA整合。次纳摩尔到纳摩尔水平Elvitegravir抑制HIV-1复制,包括多种亚型和多种耐药临床分离和HIV-2株,有效浓度为50%。Elvitegravir抑制携带抗NRTI, NNRTI和PI相关基因型的HIV-1 临床分离。逆转录之后,蛋白裂解之前, Elvitegravir抑制HIV复制,与整合步骤一致。Elvitegravir抑制链转移产物的合成, IC ₅₀ 为54nM。Elvitegravir通过抑制IN-调节的链转移而抑制整合。Elvitegravir抑制HIV载体的整合,作为荧光素酶实验的阳性对照, EC ₅₀ 为0.8nM。Elvitegravir抑制mIV感染的复制, IC ₅₀ 为5.8nM,也抑制灵长类动物的逆转录病毒SIV(IC ₅₀ 为0.5nM),说明IN抑制剂具有抗多种逆转录病毒的活性。EVG作用于外周血单个核细胞,有效作用于HIV-1和HIV-2,且具有无血清抗病毒活性, IC ₅₀ 为0.3-0.9nM。 | | | | |
| 体内研究 | N/A | | | | |
| 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 | N/A |

| 细胞实验 | |
|------|-----------|
| 细胞系 | MT-2细胞 |
| 浓度 | 0.5nM或0.1 |
| 处理时间 | 31小时 |

| | |
|----|---|
| 方法 | HIV-1IIIIB感染MT-2细胞(2×10^5 个), 然后用0.5nM或0.1nM Elvitegravir处理。在37°C下温育, 知道观察到广泛的细胞病变效应(CPE), 收集上清液, 用于进一步培养新鲜的MT-2细胞。当观察到明显的CPE时, Elvitegravir浓度提高。在指定步骤, 从感染的MT-2细胞中抽提前病毒DNA, 然后进行PCR, 再进行测序。在指定步骤, 通过MAGI实验或产生p24测定对Elvitegravir的敏感性。 |
|----|---|

| 动物实验 | |
|------|-----|
| 动物模型 | N/A |
| 配制 | N/A |
| 剂量 | N/A |
| 给药方式 | N/A |

➤ **参考文献:**

1. Shimura K, et al. J Virol. 2008, 82(2), 764-774.
2. Lampiris HW. Expert Rev Anti Infect Ther. 2012, 10(1), 13-20.

包装清单:

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|-----------------------------|------------|
| SD8491-10mM | Elvitegravir (Integrase抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SD8491-5mg | Elvitegravir (Integrase抑制剂) | 5mg |
| SD8491-25mg | Elvitegravir (Integrase抑制剂) | 25mg |
| — | 说明书 | 1份 |

保存条件:

-20°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°C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性, 操作时请小心, 并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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的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