

Telbivudine ; 2-脱氧-L-胸苷 ; 替比夫定

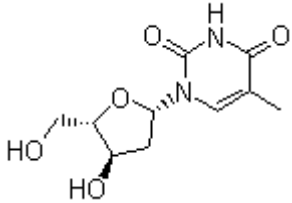
产品编号 : MB1797

质量标准 : >99%,BR

包装规格 : 200MG;1G

产品形式 : 白色至微黄色粉末

基本信息

分子式	C10H14N2O5	结构式	
分子量	242.23		
CAS No.	3424-98-4		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 48 mg/mL warmed (198.15 mM) Water : 48 mg/mL warmed (198.15 mM) Ethanol : 2 mg/mL warmed (8.25 mM)		
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 : 替比夫定 Telbivudine 是特异的 HBV 复制抑制剂。

别名 : Epavudine; L-Thymidine; NV 02B ; 2,4(1H,3H)-Pyrimidinedione, 1-(2-deoxy-β-L-erythro-pentofuranosyl)-5-methyl

物理性状及指标 :

外观 :白色至微黄色粉末

熔点 :188-190 °C

溶解性 :溶于水(48 mg/ml , 25°C), DMSO (48 mg/ml , 25°C), 和乙醇(2 mg/ml , 25°C).

干燥失重 :≤0.5%

含量 :>99%

IC50 :人免疫缺陷病毒 1 : EC50> 0.6 mM

储存条件 : 常温, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Telbivudine 是一种 HBV 逆转录酶抑制剂, 用于治疗乙型肝炎感染。
靶点	Reverse transcriptase
体外研究	Telbivudine 对 HBV 和其它肝炎 DNA 病毒显示出有效的, 选择性的, 特异性抗病毒活性。 Telbivudine 被细胞内胸苷激酶磷酸化为活性三磷酸盐形式, 其在细胞内的半衰期为 14 小时。 Telbivudine 5'-三磷酸盐通过与天然底物 dTTP 竞争, 抑制 HBV DNA 聚合酶(逆转录酶)。 Telbivudine 显著增加 MHV-3 诱导的巨噬细胞中肿瘤坏死因子 α 和白介素 2 的产生。 Telbivudine 显著提高干扰素 γ 的血清水平。Telbivudine 处理增强 T 细胞增殖和分泌细胞分子的能力, 但不影响感染肝细胞的细胞毒性。Telbivudine 处理抑制程序化死亡配体 1 在 T 细胞中的表达。Telbivudine 分别以 0.5 (N236T) 和 1.0 (A181V 与 A194T) 倍数改变, 依然具有活性。 Telbivudine 对 lamivudine 耐受的 HBV 菌株突变体 L180M/M204V/I 没有活性, 但是对 M204V 单突变体在体外依然具有活性, 这可能解释了菌株对 telbivudine 和 lamivudine 耐药性的差

异。

美仑相关产品推荐

MB1797-S	替比夫定(标准品)
MB25644	替比夫定-d3

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。替比夫定是一种合成的胸腺嘧啶核苷类似物，具有抑制乙型肝炎病毒脱氧核糖核酸(HBV DNA)聚合酶的活性。替比夫定可被细胞激酶磷酸化，转化为具有活性的三磷酸盐形式，三磷酸盐在细胞内的半衰期为 14 小时。替比夫定-5' -三磷酸盐通过与 HBV DNA 聚合酶(逆转录酶)的天然底物-胸腺嘧啶-5' -三磷酸盐竞争，抑制该酶活性。替比夫定-5' -三磷酸盐掺入病毒 DNA 可导致 DNA 链合成终止，从而抑制 HBV 复制。替比夫定同时是 HBV 第一条链($EC_{50}=0.4-1.3\mu M$)与第二条链($EC_{50}=0.12-0.24\mu M$)合成的抑制剂，而且对第二条链的抑制作用更明显。替比夫定-5' -三磷酸盐即使在浓度达到 $100\mu M$ 时对人细胞 DNA 聚合酶 α 、 β 或 γ 也没有抑制作用。替比夫定在浓度达 $10\mu M$ 时，在 HepG2 细胞中没有发现明显的线粒体毒性。在表达 HBV 的人肝癌细胞系 2.2.15 和感染鸭乙型肝炎病毒(DHBV)的原代鸭肝细胞中，替比夫定抑制病毒合成的半数有效浓度(EC_{50})约为 $0.2\mu M$ 。在细胞培养中替比夫定与阿德福韦酯的抗 HBV 活性有叠加作用，且不被艾滋病病毒核苷类逆转录酶抑制剂地达诺新和司他夫定所拮抗。替比夫定对人免疫缺陷病毒(HIV)I 型无活性(EC_{50} 值(200(M)，而且不拮抗阿巴卡韦、地达诺新、恩曲他滨、拉米夫定、司他夫定、替诺福韦或齐多夫定的抗 HIV 活性。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	4.1283 mL	20.6415 mL	41.2831 mL
5 mM	0.8257 mL	4.1283 mL	8.2566 mL
10 mM	0.4128 mL	2.0642 mL	4.1283 mL
50 mM	0.0826 mL	0.4128 mL	0.8257 mL

【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(M ²)	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。