

## 司他夫定 ; Stavudine

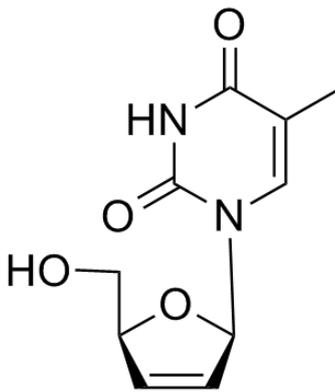
产品编号 : MB1952

质量标准 : >98, BR, 可用于细胞培养

包装规格 : 1 G ; 5 G ;

产品形式 : 白色或类白色粉末

### 基本信息

分子式	C10H12N2O4	结构式	
分子量	224.22		
CAS No.	3056-17-5		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO:45 mg/mL (200.7 mM)		
	Ethanol:15 mg/mL (66.9 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 :** 司他夫定 Stavudine 是核苷类似物, 能抑制 HIV 逆转录酶。

**别名 :** d4T ; BMY-27857, Sanilvudine, NSC 163661

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色或类白色粉末

熔点 : .....165-166°C

溶解性 : .....DMSO:45 mg/mL (200.7 mM) ; Ethanol:15 mg/mL (66.9 mM) ; Water:Insoluble

密度 : .....1.38 g/cm<sup>3</sup> (预测)

含量 : .....>98

IC50 : .....ADMET: IC50 = 20 nM; 人类免疫缺陷病毒 1: IC50 = 0.1 μM; CEM: IC50 = 0.6 μM (人);

.....MT4: IC50 = 1.2 μM (人); 血液单核细胞活性 : IC50 = 250 μM

.....半数致死剂量 (LD50) 经口 - 大鼠 - 4,000 mg/kg

**储存条件 :** 常温, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	Stavudine (d4T)是一种核苷类似物逆转录酶抑制剂 ( NARTI ), 有效作用于 HIV。
靶点	Reverse transcriptase
体外研究	Stavudine 改变脂质表型, 降低参与脂类代谢的基因表达和脂质含量, 即 C / EBPalpha , 过氧化物酶体增殖物激活受体 γ , 脂肪细胞脂质结合蛋白 2 , 脂肪酸合酶和乙酰辅酶 A 羧

	化酶。Stavudine 驱动 5-10% 的 3T3-F442A 细胞的凋亡，并降低分化的 3T3-L1 脂肪细胞的脂质含量和的存活。Stavudine 增加线粒体质量 2 - 4 倍，并降低线粒体膜电位 (JC-1 染色)。Stavudine 抑制 HIV-I 对 PBMC 中 p24 抗原的产生，EDsos 从 0.04 $\mu$ M 到 0.2 $\mu$ M。Stavudine 产生显著的线粒体功能障碍，蜂窝乳酸与丙酮酸的比率增加 1.5 倍。Stavudine 引起剂量依赖性线粒体 DNA 扩增减少和丰富的线粒体氧化应激的标志物的关联增加。Stavudine 提高线粒体活性氧 (ROS)，增强线粒体氧化应激，并且有助于对 NRTI 诱导的毒性。
<b>体内研究</b>	Stavudine (500 毫克/千克/天) 导致显著缺乏氧化线粒体病变 (长聚合酶链反应实验)，并且瘦鼠的正常血乳酸/丙酮酸的比率降低。在瘦型小鼠中，Stavudine (500 毫克/千克/天) 能降低肝和肌肉中的 mtDNA 量，空腹也能引起酮症酸中毒而不改变 mtDNA。Stavudine (500 毫克/千克/天) 仅在肥胖小鼠中耗尽 WAT 线粒体 DNA。

**美仑相关产品推荐**

MB1952-S	<u>司他夫定(标准品)</u>
MB25745	<u>司他夫定-d3</u>

**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。司他夫定是胸苷类似物，对体外人类细胞中 HIV 的复制有抑制作用。司他夫定被细胞激酶磷酸化后形成有活性的代谢物三磷酸司他夫定。三磷酸司他夫定抑制 HIV 逆转录酶，其机制包括与自然底物三磷酸脱氧胸苷竞争 ( $K_i=0.0083-0.032\mu\text{M}$ )，以及掺入至病毒 DNA，因司他夫定无 3' 羟基，从而终止 DNA 链的延长。三磷酸司他夫定抑制细胞  $\beta$  和  $\gamma$  DNA 多聚酶，也显著减少线粒体 DNA 的合成。

**储液配置：**

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	4.4601 mL	22.3005 mL	44.6010 mL
5 mM	0.8920 mL	4.4601 mL	8.9202 mL
10 mM	0.4460 mL	2.2301 mL	4.4601 mL
50 mM	0.0892 mL	0.4460 mL	0.8920 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。

**参考文献**

- [1] Caron M, et al. AIDS, 2004, 18(16), 2127-2136.
- [2] Merrill DP, et al. J Infect Dis, 1996, 173(2), 355-364.
- [3] Velsor LW, et al. Toxicol Appl Pharmacol, 2004, 199(1), 10-19.

## 活性化合物操作注意事项

**1 产品分类：**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。