

Maraviroc ; 马拉维若

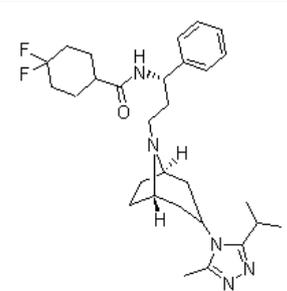
产品编号 : MB1959

质量标准 : >98%,CCR5 拮抗剂

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : powder

基本信息

分子式	C29H41F2N5O	结构式	
分子量	513.67		
CAS No.	376348-65-1		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (194.67 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 100 mg/mL (194.67 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 : Maraviroc 是一种选择性的 **CCR5** 拮抗剂, 抑制 MIP-1 α (**IC₅₀** , 3.3 nM) , MIP-1 β (**IC₅₀** , 7.2 nM) 和 RANTES (**IC₅₀** , 5.2 nM) 结合到表达 CCR5 的 HEK-293 细胞膜。

别名 : UK-427857; Selzentry; Celsentri ; Maraviroc ; 马拉维若

物理性状及指标 :

外观 :powder

溶解性 :DMSO :100 mg/mL (194.67 mM) ;Water : Insoluble ;Ethanol : 100 mg/mL (194.67 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20°C , 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Maraviroc 是一种 CCR5 拮抗剂, 作用于 MIP-1 α , MIP-1 β 和 RANTES , 无细胞试验中 IC50 分别为 3.3 nM , 7.2 nM 和 5.2 nM。			
靶点	CCR5 (Cell-free assay)	MIP-1 α (Cell-free assay)	RANTES (Cell-free assay)	MIP-1 β (Cell-free assay)
		3.3 nM	5.2 nM	7.2 nM
体外研究	Maraviroc 抑制 MIP-1 β 刺激的 γ -S-GTP 结合到 HEK-293 细胞膜上, 说明 Maraviroc 可抑制 GDP-GTP 在 CCR5/G 蛋白复合体上交换的趋化因子依赖性刺激。Maraviroc 也抑制趋化因子诱导的细胞内钙重新分配的下游事件, 作用于 MIP-1 β , MIP-1 α 和 RANTES 时, IC50s 为 7 到 30 nM。在相同实验中, Maraviroc 即使浓度高达 10 μ M, 也不会触发细胞内钙释放, 说明 Maraviroc 缺乏 CCR5 兴奋剂活性。与此相应地, Maraviroc 也不能诱导 CCR5 内化。Maraviroc 低纳摩尔浓度时, 也有效作用于 HIV-1 Ba-L。Maraviroc 抑制所有 200 种假型病毒, 平均 IC90 为 13.7 nM。在浓度高达其 IC50 的 1000 倍时, Maraviroc			

	对其他 chemokine receptors (CCR1, 2, 3, 4, 7, 8; CXCR1, 2) 没有相关临床程度的抑制作用
体内研究	Maraviroc 作用于大鼠的半衰期为 0.9 小时，作用于犬类的半衰期为 2.3 小时。随后 Maraviroc 按 2 mg/kg 剂量口服给药犬类，1.5 小时后达到 C _{max} (256 ng/ml)，生物有效性为 40%。Maraviroc 作用于大鼠，大约 30% 给药剂量从肠道吸收。[1]雌性 RAG-hu 小鼠阴道内部加入 Maraviroc 凝胶后，再阴道注入 HIV-1 1 小时。Maraviroc 凝胶处理的小鼠完全免受 HIV-1 感染，而安慰剂处理的小鼠则全部感染。说明 Maraviroc 完全保护小鼠免受 HIV-1 感染。在安慰剂处理的病毒感染小鼠内，CD4 T 细胞明显下降，而 Maraviroc 凝胶处理小鼠中水平稳定。

美仑相关产品推荐

MB25752	马拉维若-d6
MB25753	3-羟甲基马拉维若-d6
MB25755	4-羟苯基马拉维若-d6
MB25750	脱[1-(4,4-二氟代环己烷甲酰胺)-1-苯丙基]马拉维若-d6

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。Maraviroc 是 CCR5 趋化因子受体拮抗剂和抗逆转录病毒进入抑制剂。Maraviroc 通过阻断病毒外壳蛋白 gp120 与受体的相互作用而抑制 HIV 的进入。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.9468 mL	9.7339 mL	19.4678 mL
5 mM		0.3894 mL	1.9468 mL	3.8936 mL
10 mM		0.1947 mL	0.9734 mL	1.9468 mL
50 mM		0.0389 mL	0.1947 mL	0.3894 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	趋化因子与 CCR5 结合的抑制作用： 使用稳定表达受体或膜及其制品的昆虫 HEK-293 细胞测量 125I-标记的 MIP-1 α ，MIP-1 β ，和 RANTES 与 CCR5 结合情况。细胞按 2 \times 10 ⁶ 个细胞/ml 的密度再悬浮在结合 buffer (50 mM HEPES 含 1 mM CaCl ₂ ，5 mM MgCl ₂ ，和 0.5% 牛血清蛋白[BSA]，调节 pH 为 7.4) 中。为了制备膜，PBS 冲洗的细胞再悬浮在 裂解 buffer (20 mM HEPES，1 mM CaCl ₂ ，1 片 COMPLETE /50 mL，pH 7.4) 中，然后在 Polytron 手持匀浆器中搅匀，在 40,000 \times g 下超速离心 30 分钟，再悬浮在 结合 buffer 中，蛋白浓度为 0.25 mg/mL (96-孔板的每孔中含 12.5 μ g 膜蛋白)。制备 125I-放射性标记的 MIP-1 α ，MIP-1 β ，和 RANTES，在 结合 buffer 中稀释，终浓度为 400 pM。每孔加入 Maraviroc 稀释液，终体积为 100 μ L，实验板温育 1 小时，通过预阻断和冲洗的 Unifilter 板过滤，计数，烘干过夜。
细胞实验：	Cell lines: PHA 刺激的 PBMC 或 PM-1 细胞 Concentrations: 0-1 μ M Incubation Time: 5 天或 7 天 Method:

	在 24 孔组织培养板上进行药物敏感性试验。在 DMSO 中制备重复的 8 点连续稀释 Maraviroc，实验中 DMSO 终浓度为 0.1% (vol/vol)。PHA 刺激的 PBMC 或 PM-1 细胞感染细胞，在 37°C 下进行 1 小时。细胞随后稀释一次， 3.6×10^5 PBMC 或 2.0×10^5 PM-1 细胞加到含稀释 Maraviroc 的每孔中。实验板在 37°C 下在含 5% CO ₂ (vol/vol) 环境下温育 5 天 (实验室适应株) 或 7 天 (原始分离株)。所有实验中含 Saquinavir (一种 HIV-1 蛋白酶抑制剂) 和 RANTES。
动物实验：	Animal Models: 人性化的 BALB/c-Rag2 ^{-/-} γc ^{-/-} 和 BALB/c-Rag1 ^{-/-} γc ^{-/-} (RAG-hu) 小鼠 Formulation: 溶于 PBS ,进行无菌过滤 ,然后调整浓度为 4 mg/mL (7.8 mM)。加入 3.4% 羟基-乙基纤维素 (HEC)凝胶制剂 ,在 2.2% HEC 凝胶中获得终浓度为 5 mM 的 Maraviroc 。 Dosages: ~64 μg Administration: 25μL 凝胶配方小心地加到小鼠的阴道穹窿中。

【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(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。