

硫酸茚地那韦 ; Indinavir sulfate

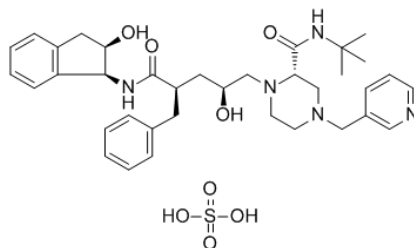
产品编号 : MB2001

质量标准 : >97%

包装规格 : 1 G ;

产品形式 : 结晶性粉末

基本信息

分子式	C36H47N5O4.H2SO4	结 构 式	
分子量	711.87		
CAS No.	157810-81-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 20mg/ml		
	溶于水、甲醇		
	几乎不溶于己烷		
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 : 硫酸茚地那韦 Indinavir(MK-639; L735524)硫酸盐是 HIV 蛋白酶抑制剂, 具有很好的口服生物相容性。

别名 : MK-639 sulfate; L735524 sulfate ; Crixivan ; D-erythro-Pentonamide, 2,3,5-trideoxy-N-[(1S,2R)-2,3-dihydro-2-hydroxy-1H-inden-1-yl]-5-[(2S)-2-[[[(1,1-dimethylethyl)amino]carbonyl]-4-(3-pyridinylmethyl)-1-piperazinyl]-2-(phenylmethyl)-, sulfate (1:1)

物理性状及指标 :

外观 :白色或类白色结晶性粉末

熔点 :150-153 °C (dec.)°C

溶解性 :DMSO 20mg/ml ; 溶于水、甲醇 ; 几乎不溶于己烷

含量 :98.5~101.5%

IC50 :1 型人类免疫缺陷病毒蛋白酶 : IC50 = 0.41 nM (1 型人类免疫缺陷病毒);

.....1 型人类免疫缺陷病毒 : EC50= 5.5 nM; HIV-1 M:B_Lai: EC50= 8.71 nM;

.....1 型人类免疫缺陷病毒 : IC50 ≤ 10 nM; 人 T-嗜淋巴细胞病毒 1 : IC50 = 22 nM

.....半数致死剂量 (LD50) 经口 - 大鼠 - > 5,000 mg/kg

.....半数致死剂量 (LD50) 经口 - 老鼠 - > 5,000 mg/kg

.....半数致死剂量 (LD50) 经口 - 狗 - > 640 mg/kg

.....半数致死剂量 (LD50) 腹腔内的 - 大鼠 - > 5,000 mg/kg

.....半数致死剂量 (LD50) 腹腔内的 - 老鼠 - > 5,000 mg/kg

.....半数致死剂量 (LD50) 腹腔内的 - 狗 - > 640 mg/kg

储存条件 : -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性 :

茚地那韦硫酸盐 (MK-639 硫酸盐 ; L735524 硫酸盐) 是一种有效且特异的 HIV 蛋白酶抑制剂, 具有良好

的口服生物利用度。目的：HIV 蛋白酶茚地那韦 (MK-639) 是一种蛋白酶抑制剂，作为高活性抗逆转录病毒疗法 (HAART) 的一部分，用于治疗 HIV 感染和 AIDS。MK-639 似乎具有显著的剂量相关抗病毒活性，并且耐受性良好。由突变酶催化的抗病毒药物茚地那韦的抑制常数 (K_i) 相对于 PR (PR) 和 PR (G73S) 分别为 PR (L24I) 和 PR (I50V) 的三倍和 50 倍。Pr (L24I) 和 PR (I50V) 的二聚体离解常数 (K_d) 估计为约 20 nm, PR (G73S) 低于 5 nm, 在茚地那韦或 P2 / NC 底物类似物的复合物中测定了突变株 PR (L24I)、PR (I50V) 和 PR (G73S) 的 PR. Crystal 结构。

美仑相关产品推荐

MB25819	茚地那韦-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。艾滋病病毒蛋白酶茚地那韦 (MK-639) 是一种蛋白酶抑制剂，用作高效抗逆转录病毒疗法 (HAART) 的成分，用于治疗 HIV 感染和 AIDS。MK-639 似乎具有显著的剂量相关抗病毒活性并且耐受性良好。茚地那韦抑制 HIV-1 蛋白酶，可用于相关领域的科学研究。

储液配置：The solubility of indinavir(sulfate) in PBS,Ph7.2,is approximately 10mg/ml.We do not recommend storing the aqueous solution for more than one day.

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.4048 mL	7.0238 mL	14.0475 mL
5 mM	0.2810 mL	1.4048 mL	2.8095 mL
10 mM	0.1405 mL	0.7024 mL	1.4048 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. Bavinger, C.,Bendavid, E.,Niehaus, K., et al. Risk of cardiovascular disease from antiretroviral therapy for HIV: A systematic review. PLoS One 8(3), e59551 (2013).
2. Dorsey, B.D.,McDonough, C.,McDaniel, S.L., et al. Identification of MK-944a: A second clinical candidate from the hydroxylaminepentanamideisostere series of HIV protease inhibitors. Journal of Medicinal Chemistry 43(18), 3386-3399 (2000).
3. Liu, F.,Boross, P.I.,Wang, Y.F., et al. Kinetic, stability, and structural changes in high-resolution crystal structures of HIV-1 protease with drug-resistant mutations L24I, I50V, and G73S. Journal of Molecular Biology 354(4), 789-800 (2005).

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。给药剂量的时候，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。