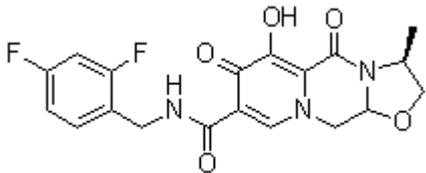


Cabotegravir ; GSK744 ; GSK1265744

产品编号 : MB3486
 质量标准 : >98%,BR
 包装规格 : 5MG;25MG
 产品形式 : powder

基本信息

分子式	C19H17F2N3O5	结 构 式	
分子量	405.35		
CAS No.	1051375-10-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 38 mg/mL warmed (93.74 mM) Water : Insoluble Ethanol : 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 :卡博特韦 Cabotegravir 是一种有效的 HIV 整合酶抑制剂, 用于治疗 and 预防艾滋病病毒感染, Cabotegravir 抑制 OAT1 (IC50 为 0.81 μM) 和 OAT3 (IC50 为 0.41 μM)。

别名 : GSK-1265744; S/GSK1265744 ; 卡博特韦

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色粉末

溶解性 :DMSO : 38 mg/mL warmed (93.74 mM);Water : Insoluble;Ethanol : Insoluble

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	Cabotegravir (GSK744, GSK1265744)是一种长效 HIV integrase 抑制剂, 作用于广泛的 HIV 亚型, 抑制了 HIV-1 integrase 催化的链转移反应的 IC50 为 3 nM。
靶点	HIV integrase
体外研究	GSK1265744 抑制 HIV 复制 对 HIV-1 Ba-L 和 NL432 的 EC50 分别为 0.22 nM 和 0.34-1.3 nM。GSK1265744 在增殖的 IM-9, U-937, MT-4, 和 Molt-4 细胞系中产生细胞毒性, CC50 分别为 6.4, 5.0, 9.2, 和 13 μM。
体内研究	GSK1265744 (50 mg/kg)防止三个高剂量 SHIV 感染恒河猴。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3564	BMS-707035
MB11327	人体免疫缺陷病毒整合酶抑制剂 (1)

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。Cabotegravir 是一种有效的 HIV 整合酶抑制剂, 作为口服先导片和长效注射剂用于治疗 and 预防 HIV 感染。本品仅供科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.4670 mL	12.3350 mL	24.6700 mL
5 mM		0.4934 mL	2.4670 mL	4.9340 mL
10 mM		0.2467 mL	1.2335 mL	2.4670 mL
50 mM		0.0493 mL	0.2467 mL	0.4934 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	体外链转移测定: GSK1265744 的抑制浓度在链转移试验中使用重组 HIV IN 测量。整合酶与生物素化供体 DNA-链霉亲和素包被的 SPA 珠复合物，通过培养 2 μM 纯化的重组整合酶与 0.66 μM 生物素化供体 DNA-4 mg/mL 链霉亲和素包被的 SPA 珠在 25 mM MOPS 钠, pH 7.2, 23 mM NaCl, 和 10 mM MgCl ₂ 在 37°C下培养 5 分钟形成。这些珠子被离心，并与稀释的 INSTIs 在 37°C 下预培养 60 分钟。接下来， ^[3H] 标记的靶 DNA 底物加入到终浓度为 7 nM 的底物中，链转移反应在 37°C 下培养 25 到 45 分钟，这允许链转移中供体 DNA 到放射性标记的靶 DNA 线性增加。信号使用 Wallac MicroBeta 闪烁板阅读器读取。
细胞实验：	Cell lines: 人白血病和淋巴瘤细胞系(IM-9, U-937, MT-4, 和 Molt-4) Concentrations: ~20 μM Incubation Time: -- Method: 体外生长抑制(细胞毒性)研究使用 GSK1265744 在增殖的人白血病和淋巴瘤细胞系(IM-9, U-937, MT-4, 和 Molt-4)以及刺激的和未刺激的人 PBMCs 中进行。作为细胞生长的替代物，ATP 水平使用 CellTiter-Glo 荧光素酶试剂定量。
动物实验：	Animal Models: 恒河猴 Formulation: -- Dosages: 50 mg/kg Administration: --

【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。

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。