

## Cobicistat (GS9350) ; 科比司他 ( Cobicistat )

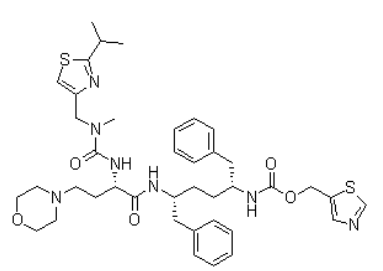
产品编号 : MB3815

质量标准 : >98% , 有效的 CYP3A 选择性抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C40H53N7O5S2	结 构 式	
分子量	776.02		
CAS No.	1004316-88-4		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO 100 mg/mL (128.86 mM) Water Insoluble Ethanol 100 mg/mL (128.86 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 :** 科比司他 Cobicistat 是一种有效的, 选择性的 cytochrome P450 3A (CYP3A) 抑制剂。

**别名 :** 科比司他; GS-9350;GS 9350; (3R,6R,9S)-12-Methyl-13-[2-(1-methylethyl)-4-thiazolyl]-9-[2-(4-morpholinyl)ethyl]-8,11-dioxo-3,6-bis(phenylmethyl)-2,7,10,12-tetraazatridecanoic acid 5-thiazolylmethyl ester

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO 100 mg/mL (128.86 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol 100 mg/mL (128.86 mM)

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20°C , 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Cobicistat (GS-9350) 是有效的 CYP3A 选择性抑制剂, IC50 为 30 - 285 nM。
<b>靶点</b>	CYP3A
<b>IC50</b>	30 - 285 nM

<b>体外研究</b>	<p>Cobicistat (GS-9350)是有效的人类细胞色素 P450 3A (CYP3A)酶的选择性抑制剂。GS-9350 抑制 CYP3A , IC50 为 30 nM 到 285 nM。与 Ritonavir 相比, GS-9350 缺乏 抗 HIV 活性,在 MT-2 HIV 感染实验中, 作用于 HIV-1 蛋白酶 IC50 为 &gt;30<math>\mu</math> M , EC50 为 &gt;30<math>\mu</math>M , 所以 GS-9350 更适合用于促进抗 HIV 药物, 在选择有潜力的抗 HIV 突变体的药物上没有风险。GS-9350 显示降低药物相互作用的倾向, 改善药物的耐受性比 Ritonavir 有效。</p>
-------------	---

**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)**

MB2052	Abiraterone
MB7550	Galeterone (TOK001)

**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。Cobicistat 是一种用于治疗人类免疫缺陷病毒(HIV)感染的实验性药物。与 ritonavir (Norvir)一样, cobicistat 之所以引起人们的兴趣,并不是因为它具有抗艾滋病病毒的特性,而是因为它能够抑制肝脏酶的代谢,这些酶代谢用于治疗艾滋病病毒的其他药物,尤其是目前正在研究的艾滋病毒整合酶抑制剂 elvitegravir。将 cobicistat 与 elvitegravir 联合使用,可以使 elvitgravir 在体内以较低的剂量达到较高的浓度,理论上增强了 elvitgravir 的病毒抑制作用,同时减少了其不良副作用。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.2886 mL	6.4431 mL
5 mM	0.2577 mL	1.2886 mL	2.5773 mL	
10 mM	0.1289 mL	0.6443 mL	1.2886 mL	
50 mM	0.0258 mL	0.1289 mL	0.2577 mL	

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验：</b>	<p><b>细胞色素 P450 抑制实验:</b></p> <p>在人类肝微粒体组分中重复测定对细胞色素 P450 活性的抑制作用。反应条件与温育时间和肝微粒体蛋白浓度呈线性相关。底物浓度等于或低于在相同反应条件下测定的各自的 <math>K_m</math> 值。使用特定的,内标准控制的 HPLC MS/MS 检测测定代谢物和/或底物的浓度。在形成代谢产物的反应过程中检测到有少于 20%的底物消耗。除非另有说明,微粒体组分在磷酸钾缓冲液中稀释,然后与底物和抑制剂在 37<math>^{\circ}</math>C 下预温育 5 分钟,加入 NADPH 反应系统开始反应,再在 37<math>^{\circ}</math>C 下振荡温育。进行平行实验,检测酶选择性的阳性对照抑制剂。在适当时间,除去混合物的等分试样,加入有各自内部标准的甲醇和乙腈混合物终止反应。离心后的上清液等分试样进行 HPLC-MS/MS 分析。</p>
--------------	---

## 【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，请选择合适溶剂，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，否则会严重影响化合物活性，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。