Cobicistat (GS9350)

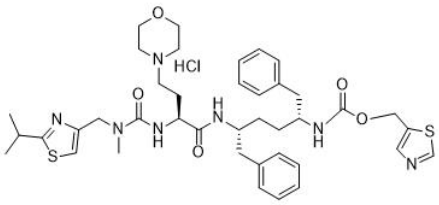
产品编号：MB3815

质量标准：>98%，有效的 CYP3A 选择性抑制剂

包装规格：5mg

产品形式：solid

基本信息

分子式	$C_{40}H_{53}N_7O_5S_2$; $C_{40}H_{54}ClN_7O_5S_2$（盐酸盐）	结构式	
分子量	776.02;　812.49（盐酸盐）		
CAS No.	1004316-88-4; 1407483-45-7		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 100 mg/mL		
	Water Insoluble		
	Ethanol 100 mg/mL		
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：可比司他 Cobicistat 是一种有效的，选择性的 cytochrome P450 3A (CYP3A) 抑制剂。

别名：可比司他; 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(phenyl methyl)-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；Water Insoluble；Ethanol 100 mg/mL

含量：……>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

运输条件：湿冰运输（按季节）

生物活性：

产品描述	Cobicistat (GS-9350) 是有效的 CYP3A 选择性抑制剂，IC50 为 30 - 285 nM。
靶点	CYP3A
IC50	30 - 285 nM
体外研究	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>30μM，EC50 为>30μM，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。

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 ritonovir (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。

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验：	**细胞色素 P450 抑制实验:** 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 K_m 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°C 下预温育 5 分钟，加入 NADPH 反应系统开始反应，再在 37°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。

【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。

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)

S240902