

Telaprevir (VX-950) ; 特拉匹韦

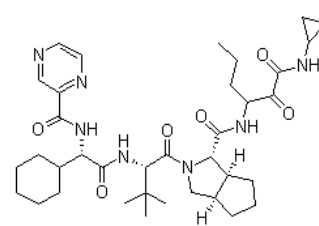
产品编号 : MB4254

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C36H53N7O6	结 构 式	
分子量	679.85		
CAS No.	402957-28-2		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 136 mg/mL Water <1 mg/mL Ethanol <1 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 : 特拉普韦 Telaprevir 是一种有效的选择性的可逆 HCV NS3-4A protease 抑制剂。

别名 : VX-950 ; Cyclopenta[c]pyrrole-1-carboxamide, (2S)-2-cyclohexyl-N-(2-pyrazinylcarbonyl)glycyl-3-methyl-L-valylN-[(1S)-1-[2-(cyclopropylamino)-2-oxoacetyl]butyl]octahydro-, (1S,3aR,6aS)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 136 mg/mL ; Water <1 mg/mL ; Ethanol <1 mg/mL

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	Telaprevir 是丙型肝炎病毒(HCV)NS3-4A 丝氨酸蛋白酶抑制剂,IC50 为 0.354 μM。
靶点	HCV NS3-4A 丝氨酸蛋白酶
IC50	0.354 μM

体外研究	Telaprevir 作用于 Con1(基因型 1b) 亚基因组 HCV 复制细胞, 抑制丙型肝炎病毒 NS3-4A 丝氨酸蛋白酶, 导致病毒多聚蛋白加工受抑制, 且随后使病毒 RNA 复制, 全部 HCV RNA 水平和蛋白水平降低, 这种作用存在时间和剂量依赖性。Telaprevir 显著促进对 HCV RNA 复制的抑制, 温育 24, 48, 72 和 120 小时, 则 IC50 值分别为 0.574 μ M, 0.488 μ M, 0.210 μ M 和 0.139 μ M, 这种作用存在时间依赖性。Telaprevir 处理 HCV 复制细胞, 亲本 Huh-7 和 HepG2 细胞 48 小时后, 对细胞没有毒性。17.5 μ M Telaprevir 完全消除复制细胞中 HCV RNA, 撤销处理 13 天后, 没有反弹。Telaprevir 和 IFN- α 联用, 与两种试剂单独使用相比, 适度提高协同作用, 降低 HCV RNA 复制, 和抑制耐药突变, 但是没有明显毒性。
体内研究	Telaprevir 按 10 和 25 mg/kg 剂量, 口服处理小鼠模型, 降低 HCV 蛋白酶依赖的裂解和 SEAP 从肝脏分泌到血液中, 分别降低 18.7% 和 18.4%。Telaprevir 按 200 mg/kg 剂量处理基因型 1b HCV 感染人肝细胞的小鼠 1 周, 导致 HCV RNA 降低, 和 MK-0608 (50 mg/kg) 联用处理小鼠, 持续 4 周, 可完全除去鼠体内病毒。
特征	与 BILN 2061(一种非共价抑制剂) 不一样, Telaprevir 是 NS3-4A 蛋白酶的共价, 可逆抑制剂, 具有结合慢和解离慢的特性。

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)

MB4806	Ledipasvir (GS5885)
MB7224	Paritaprevir(ABT-450)
MB4255	Lomibuvir (VX-222, VCH-222)

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。本品 Telaprevir 是一种有效的选择性的可逆 HCV NS3-4A protease 抑制剂。可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 \ 浓 度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.4709 mL	7.3546 mL	14.7091 mL
5 mM	0.2942 mL	1.4709 mL	2.9418 mL
10 mM	0.1471 mL	0.7355 mL	1.4709 mL
50 mM	0.0294 mL	0.1471 mL	0.2942 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	测定 HCV 抗体活性: 含自我复制, 亚基因组 HCV 复制的稳定 Huh-7 细胞, 与 HCV 抗体实验中使用的 I ₃₇₇ neo/NS3-
-------------	---

	3'/wt 复制一致。复制的细胞和 Telaprevir 在 37°C 下按指定时间温育, Telaprevir 事先在 含 2% FBS 和 0.5% DMSO 的 DMEM 培养基中稀释。使用 RNeasy-96 试剂盒抽提全部细胞 RNA, 使用定量 RTPCR (QRT-PCR)实验测定 IC50 而测定 HCV RNA 复制量。
细胞实验	<p>Cell lines: Huh-7, HepG2,和外周血单个核细胞(PBMC)</p> <p>Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为 1 mM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 用不同浓度 Telaprevir 处理细胞 48 小时。通过 MTS 实验测定细胞活力。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 注射重组腺病毒 (Ad-WT-HCVpro-SEAP 或 Ad-MT-HCVpro-SEAP)的 SCID 小鼠</p> <p>Formulation: 在聚乙烯吡咯烷酮(PVP)K-30 和 2%十二烷基硫酸钠中配制</p> <p>Dosages: 300 mg/kg</p> <p>Administration: 口服饲喂</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。