

## Lomibuvir (VX-222, VCH-222)

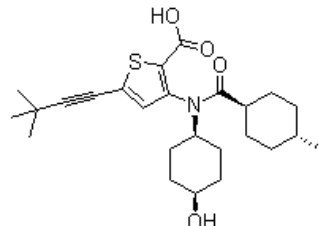
产品编号：MB4255

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;25MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C <sub>25</sub> H <sub>35</sub> NO <sub>4</sub> S	结 构 式	
分子量	445.61		
CAS No.	1026785-59-0		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：89 mg/mL (199.72 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol：89 mg/mL (199.72 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：** VX-222 (VCH-222)是新型的 HCV 聚合酶选择性抑制剂。

**别名：** 2-Thiophenecarboxylic acid, 5-(3,3-dimethyl-1-butyn-1-yl)-3-[(cis-4-hydroxycyclohexyl)[(trans-4-methylcyclohexyl)carbonyl]amino]-

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：89 mg/mL (199.72 mM)；Water Insoluble；Ethanol：89 mg/mL (199.72 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>	Lomibuvir (VX-222, VCH-222)是一种新型的，有效的，选择性的 <b>HCV</b> 聚合酶抑制剂， <b>IC50</b> 为 0.94-1.2 μM，作用于突变型 M423T 效果低 15.3 倍，作用于突变型 I482L 效果低 108 倍。
<b>特性</b>	VX-222 是新型有效和选择性的非核苷聚合酶抑制剂，作用于 C 型肝炎病毒(HCV) RNA 依赖的 RNA 聚合酶。

<b>靶点</b>	HCV NS5B 1a 0.94 μM	HCV NS5B 1b 1.2 μM
<b>体外研究</b>	VX-222 结合到 HCV RNA 依赖的 RNA 聚合酶的 II 节变构袋处。VX-222 选择性抑制 HCV NS5B 基因型 1a 和 1b，为非竞争性抑制剂,作用于 NS5B 2a 和人类 DNA 聚合酶时, IC50 分别为 0.94 和 1.2 μM。VX-222 选择性抑制 HCV 基因型 1a 和 1b, EC50 分别为 22.3 和 11.2 nM。最新研究显示 VX-222 抑制 1b/Con1 HCV 次基因复制子, EC50 为 5nM。VX-222 优先抑制引物依赖的 RNA 合成, 对重新开始的 RNA 合成没有或很弱的抑制效果。	
<b>体内研究</b>	VCH-222 作用于小鼠和犬, 显示好的药物动力谱,包括低的身体清除能力和极好的生物口服有效性, 及好的 ADME 能力。VCH-222 通过一些酶 (CYP1A1, 2A6, 2B6, 2C8, CYP 3A4, UGT1A3)进行生物转换, 在肝脏中很好地转运, 在胆汁进行分泌, 或者形成葡糖苷酸加合物。	

### 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)
MB4254	特拉匹韦

**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。VX-222 (VCH-222)是新型的 HCV 聚合酶选择性抑制剂.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	2.2441 mL	11.2206 mL	22.4411 mL
5 mM	0.4488 mL	2.2441 mL	4.4882 mL
10 mM	0.2244 mL	1.1221 mL	2.2441 mL
50 mM	0.0449 mL	0.2244 mL	0.4488 mL

### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	NS5B 抗体活性实验: 使用同源多聚 RNA 模板/引物多聚 rA/寡聚 dT, 测定新合成 RNA 中放射标记的 UTP 渗透到酶 C 端Δ21 截断倒位中的数量, 而测定 VX-222 作用于 HCV NS5B 的抑制效果。使用液态闪烁计数器定量分析渗透的放射活性。使用 NS5B 的 C 端Δ21 截断倒位测定 VX-222 抑制 HCV NS5B 基
-------------	---

	因型 1b 的体外动力学。加入 10-75 $\mu\text{M}$ 非放射性的 UTP，与 0.89- 6.70 $\mu\text{Ci}$ [ $\alpha$ -33P]标记的 UTP 混合，测定 VX-222 (1-1.5 $\mu\text{M}$ )。RNA 依赖的 RNA 合成反应在 22 $^{\circ}\text{C}$ 下进行 18 分钟。
细胞实验	<p><b>Cell lines:</b> Huh7.5 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 0.01 nM -10 <math>\mu\text{M}</math></p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b> 含 HCV RNA 复制子的 Huh7.5 细胞胰蛋白酶化，按每孔 <math>4 \times 10^4</math> 个细胞接种到 48 孔板上。第二天更换培养基，VX-222 加到 200 <math>\mu\text{L}</math> 完全培养基中。48 小时后，全部 RNA 被萃取，使用 RT-PCR 测定病毒 RNAs。使用对数曲线，通过回归曲线分析计算降低 50% HCV RNA 复制子水平 (EC50) 时的有效 VX-222 浓度。</p>
动物实验	<p><b>Animal Models:</b> 鼠或犬</p> <p><b>Formulation:</b> 溶于 30% PEG</p> <p><b>Dosages:</b> 5 mg/kg(鼠)，或 10 mg/kg(犬)</p> <p><b>Administration:</b> 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，否则会影影响化合物活性，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。