

Elvitegravir (GS-9137, JTK-303) ; 埃替拉韦

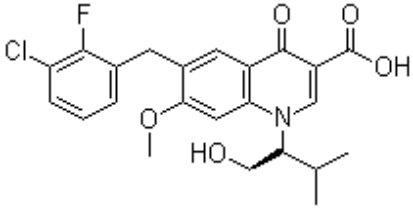
产品编号 : MB4279

质量标准 : >98% , 免疫缺陷病毒整合酶抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C23H23ClFNO5	结 构 式	
分子量	447.88		
CAS No.	697761-98-1		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 89 mg/mL (198.71 mM) Water : Insoluble Ethanol : 35 mg/mL (78.14 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 : Elvitegravir 是一种 HIV integrase 抑制剂, 作用于 HIV-1III_B , HIV-2EHO 和 HIV-2ROD。

别名 : 埃替格韦 ; GS-9137; JTK-303; EVG; D06677 ; 3-Quinolinecarboxylic acid, 6-[(3-chloro-2-fluorophenyl)methyl]-1,4-dihydro-1-[(1S)-1- (hydroxymethyl)-2-methylpropyl]-7-methoxy-4-oxo

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 89 mg/mL (198.71 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 35 mg/mL (78.14 mM)

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	Elvitegravir (GS-9137, JTK-303)是一种 HIV 抑制剂, 作用于 HIV-1 III _B , HIV-2 EHO 和 HIV-2 ROD , 无细胞试验中 IC ₅₀ 分别为 0.7 , 2.8 和 1.4 nM。		
靶点	HIV-1 III _B	HIV-2 ROD	HIV-2 EHO

	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)
	0.7 nM	1.4 nM	2.8 nM
体外研究	Elvitegravir 抑制整合酶活性，IC ₅₀ 为 6 nM。Elvitegravir 抑制 PBMC 和 PA，IC ₅₀ 分别为 0.89 和 20 nM。Elvitegravir 通过抑制 DNA 链转移而抑制 HIV-1 cDNA 整合。次纳摩尔到纳摩尔水平 Elvitegravir 抑制 HIV-1 复制,包括多种亚型和多种耐药临床分离,和 HIV-2 株,有效浓度为 50%。Elvitegravir 抑制携带抗 NRTI, NNRTI,和 PI 相关基因型的 HIV-1 临床分离。逆转录之后,蛋白裂解之前,Elvitegravir 抑制 HIV 复制,与整合步骤一致。Elvitegravir 抑制链转移产物的合成,IC ₅₀ 为 54 nM。Elvitegravir 通过抑制 IN-调节的链转移而抑制整合。Elvitegravir 抑制 HIV 载体的整合,作为荧光素酶实验的阳性对照,EC ₅₀ 为 0.8 nM。Elvitegravir 抑制 MLV 感染的复制,IC ₅₀ 为 5.8 nM,也抑制灵长类动物的逆转录病毒 SIV(IC ₅₀ 为 0.5 nM),说明 IN 抑制剂具有抗多种逆转录病毒的活性。EVG 作用于外周血单个核细胞,有效作用于 HIV-1 和 HIV-2,且具有无血清抗病毒活性,IC ₅₀ 为 0.3-0.9 nM。		

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。Elvitegravir 是一种 HIV integrase 抑制剂, 作用于 HIV-1III_B, HIV-2EHO 和 HIV-2ROD。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
浓度			
1 mM	2.2327 mL	11.1637 mL	22.3274 mL
5 mM	0.4465 mL	2.2327 mL	4.4655 mL
10 mM	0.2233 mL	1.1164 mL	2.2327 mL
50 mM	0.0447 mL	0.2233 mL	0.4465 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: MT-2 细胞</p> <p>Concentrations: 0.5 nM 或 0.1</p> <p>Incubation Time: 31 小时</p> <p>Method: HIV-1III_B 感染 MT-2 细胞(2×10^5 个), 然后用 0.5 nM 或 0.1 nM Elvitegravir 处理。在 37°C 下温育, 知道观察到广泛的细胞病变效应(CPE), 收集上清液, 用于进一步培养</p>
-------------	--

新鲜的 MT-2 细胞。当观察到明显的 CPE 时, Elvitegravir 浓度提高。在指定步骤,从感染的 MT-2 细胞中抽提前病毒 DNA, 然后进行 PCR, 再进行测序。在指定步骤, 通过 MAGI 实验或产生 p24 测定对 Elvitegravir 的敏感性。

【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。