

## Dapivirine ; TMC120

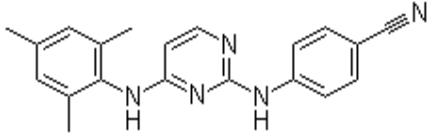
产品编号 : MB4283

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

### 基本信息

|               |   |             |  |
|---------------|---|-------------|--|
| 分子式           | C20H19N5  | 结<br>构<br>式 |  |
| 分子量           | 329.4   |             |  |
| CAS No.       | 244767-67-7   |             |  |
| 储存条件          | -20°C, 避光防潮密闭干燥   |             |  |
| 溶解性<br>(25°C) | DMSO : 34 mg/mL (103.21 mM)<br>Water : Insoluble<br>Ethanol : Insoluble |             |  |
| 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 :** Dapivirine(TMC 120, TMC 120 R147681)是 HIV 非核苷逆转录酶抑制剂 ( NNRTI ) , 能抑制包括 NNRTI 抗性的各种 HIV-1 毒株。

**别名 :** 达匹维林 ; TMC120; R147681 ; Benzonitrile, 4-[[4-[(2,4,6-trimethylphenyl)amino]-2-pyrimidinyl]amino]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 34 mg/mL (103.21 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

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> | Dapivirine (TMC120)是一种非核苷类抑制剂, 作用于 HIV 逆转录酶, IC50 为 24 nM, 抑制多种不同类型的 HIV-1 分离株, 包括多种耐 NNRTI 的分离株。Phase 3。 |
| <b>靶点</b>   | HIV reverse transcriptase 24 nM   |
| <b>体外研究</b> | Dapivirine 在纳摩尔范围, 抑制 HIV 诱导的合胞体形成, 具有低的细胞生长抑制活性。   |

|      |   |
|------|---|
|      | <p>Dapivirine 在原代培养中，浓度为 10 nM 时，显著抑制 HIV-1 感染，但是在传代培养中，完全抑制原病毒整合所需的浓度为 100nM。Dapivirine 作用于上皮细胞，T 细胞，巨噬细胞，和宫颈组织外植体，具有良好的耐受性，CC50(50%细胞毒性浓度)为 10 μM 到 20 μM。Dapivirine 有效抑制利用 X4 和 R5 的 HIV-1 毒株感染，IC50 为 1.46 nM。Dapivirine 作用于人类外宫颈外植体组织，有效地抑制 HIV-1BaL 感染，这种作用具有剂量依赖性，通过培养的外植体中 p24 释放的减少和原病毒含量来测评。Dapivirine 抑制病毒的传播到 T 细胞，这种作用具有剂量依赖性，IC50 为 0.1 nM。当病毒感染外植体时，Dapivirine 立即显著抑制 HIV 感染，IC90 为 100 nM。Dapivirine 还能够通过迁移细胞抑制病毒传播。</p> |
| 体内研究 | <p>含 Dapivirine 的凝胶处理小鼠，抑制细胞相关的 HIV 感染。Dapivirine (0.05%) 处理血浆，14 天后，C<sub>max</sub> 为 715 pg/mL, AUC 为 15 ng×h/mL，T<sub>1/2</sub> 为 89.87 小时。</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)

|        |                             |
|--------|-----------------------------|
| MB3319 | Rilpivirine;R278474;TMC 278 |
| MB1548 | Etravirine(TMC125)          |
| MB1386 | Tenofovir                   |

**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。Dapivirine(TMC 120, TMC 120 R147681)是 HIV 非核苷逆转录酶抑制剂 ( NNRTI )，能抑制包括 NNRTI 抗性的各种 HIV-1 毒株。本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

| 体<br>浓度 | 质量<br>积   |            |            |
|---------|-----------|------------|------------|
|         | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
| 1 mM    | 3.0358 mL | 15.1791 mL | 30.3582 mL |
| 5 mM    | 0.6072 mL | 3.0358 mL  | 6.0716 mL  |
| 10 mM   | 0.3036 mL | 1.5179 mL  | 3.0358 mL  |
| 50 mM   | 0.0607 mL | 0.3036 mL  | 0.6072 mL  |

#### 【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。