

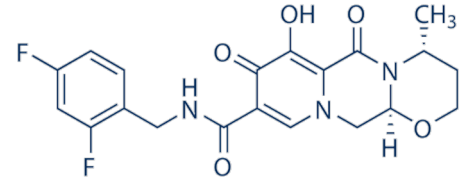
Dolutegravir (Integrase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD8500-10mM	Dolutegravir (Integrase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD8500-5mg	Dolutegravir (Integrase抑制剂)	5mg
SD8500-25mg	Dolutegravir (Integrase抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(4R,12aS)-N-[(2,4-difluorophenyl)methyl]-7-hydroxy-4-methyl-6,8-dioxo-3,4,12,12a-tetrahydro-2H-pyrido[5,6]pyrazino[2,6-b][1,3]oxazine-9-carboxamide
简称	Dolutegravir
别名	GSK 1349572, GSK1349572, Dolutegravir sodium, Dolutegravir sodium monohydrate, GSK 1349572A, GSK-1349572, GSK1349572A, S-GSK1349572, Tivicay
中文名	度鲁特韦
化学式	C ₂₀ H ₁₉ F ₂ N ₃ O ₅
分子量	419.38
CAS号	1051375-16-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 83mg/ml warming; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.19ml DMSO, 或每4.19mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD8500-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Dolutegravir (GSK1349572)是一种两个金属结合的HIV integrase抑制剂, 无细胞试验中IC ₅₀ 为2.7nM, 对耐Raltegravir的显著突变体Y143R、Q148K、N155H和G140S/Q148H具有适度的活性。				
信号通路	Microbiology				
靶点	HIV integrase	—	—	—	—
IC ₅₀	2.7nM	—	—	—	—
体外研究	S/GSK1349572对来自整合酶抑制剂-天然HIV-2感染患者的9种临床分离株表现出有效的抑制作用, EC ₅₀ 范围为0.2nM-1.4nM。在体外, S/GSK1349572抑制重组HIV-1整合酶催化的链转移, IC ₅₀ 为2.7nM。此外, S/GSK1349572有效抑制细胞中HIV复制, 如作用于感染自身灭活的PHIV慢病毒载体的外周血单核细胞(PBMCs)、MT-4细胞和CIP4细胞, EC ₅₀ 分别为0.51nM、0.71nM和2.2nM。在体外, S/GSK1349572对5种不同的非核苷逆转录抑制剂抗性病毒, 或核苷逆转录抑制剂抗性病毒表现出有效的活性, EC ₅₀ 范围为1.3nM-2.1nM。与抗野生型病毒类似, S/GSK1349572对两种蛋白酶抑制剂抗性病毒表现出同样的活性, EC ₅₀ 为0.36nM和0.37nM。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	新一代两种金属结合的HIV整合酶链转移抑制剂。				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	S/GSK1349572和其他INIs的抑制效能通过链转移试验使用重组HIV整合酶测量。整合酶和生物素化预处理的供体DNA-链霉亲和素包被的闪烁逼近测定(SPA)珠复合物, 通过将2μM纯化的重组整合酶与0.66μM生物素化供体DNA-4mg/ml链霉亲和素包被的SPA珠在25mM吗啡啉丙磺酸钠(MOPS) (pH 7.2), 23mM NaCl和10mM MgCl ₂ 于37°C下培养5分钟制备。将这些珠子离心, 并与稀释的INIs在37°C下预培养60分钟。然后加入3H-标记的靶DNA底物, 得到底物终浓度为7nM, 将链转移反应混合物在37°C下培育25到45分钟, 使供体DNA到放射性标记的靶DNA链转移线性增加。信号使用Wallac MicroBeta闪烁酶标仪读

	取。
--	----

细胞实验	
细胞系	MT-4
浓度	0到10 μ M
处理时间	4天或5天
方法	以500000或600000/ml的密度指数生长的MT-4细胞用HIV-1 菌株III _B 感染，病毒感染率为0.001，或50%组织培养感染剂量为4-10。随后将细胞等份接种到含有不同浓度S/GSK1349572的96孔板。培养4到5天后，抗病毒活性通过细胞活性试验测定，即用CellTiter-Glo 荧光试剂测量生物发光，或使用黄色四唑MTT试剂[3-(4,5-二甲基噻唑-2)-2,5-二苯基四氮唑溴盐]测量560和690nm下的吸光度确定。

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ 参考文献:

1. Charpentier C, et al. AIDS. 2010, 24(17), 2753-275
2. Kobayashi M, et al. Antimicrob Agents Chemother. 2011, 55(2), 813-821.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD8500-10mM	Dolutegravir (Integrase抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SD8500-5mg	Dolutegravir (Integrase抑制剂)	5mg
SD8500-25mg	Dolutegravir (Integrase抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01