

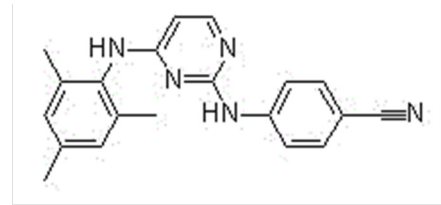
Dapivirine (Reverse Transcriptase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD8504-10mM	Dapivirine (Reverse Transcriptase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD8504-5mg	Dapivirine (Reverse Transcriptase抑制剂)	5mg
SD8504-25mg	Dapivirine (Reverse Transcriptase抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[[4-(2,4,6-trimethylanilino)pyrimidin-2-yl]amino]benzonitrile
简称	Dapivirine
别名	TMC-120, TMC120-R147681, TMC120, Dapivirinum, TMC 120
中文名	N/A
化学式	C ₂₀ H ₁₉ N ₅
分子量	329.4
CAS号	244767-67-7
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 34mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.52ml DMSO, 或每3.29mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD8504-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Dapivirine (TMC120)是一种非核苷类抑制剂, 作用于HIV逆转录酶, IC50为24nM, 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。			
信号通路	Microbiology			
靶点	HIV reverse transcriptase	—	—	—
IC50	24nM	—	—	—
体外研究	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。Dapivirine在原代培养中, 浓度为10nM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10μM到20μM。Dapivirine有效抑制利用X4和R5的HIV-1毒株感染, IC50为1.46nM。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0.1nM。当病毒感染外植体时, Dapivirine立即显著抑制HIV感染, IC90为100nM。Dapivirine还能够通过迁移细胞抑制病毒传播。			
体内研究	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, Cmax为715pg/ml, AUC为15ng×h/ml, T1/2为89.87小时。			
临床实验	N/A			
特征	N/A			

➤ 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	N/A

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A

方法	N/A
----	-----

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. Van Herreweghe Y, et al. Antimicrob Agents Chemother, 2004, 48(1), 337-339.
2. Fletcher P, et al. Antimicrob Agents Chemother, 2009, 53(2), 487-495.
3. Di Fabio S, et al. AIDS, 2003, 17(11), 1597-1604.
4. Nel AM, et al. J Acquir Immune Defic Syndr, 2010, 55(2), 161-169.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD8504-10mM	Dapivirine (Reverse Transcriptase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD8504-5mg	Dapivirine (Reverse Transcriptase抑制剂)	5mg
SD8504-25mg	Dapivirine (Reverse Transcriptase抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°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°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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的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