

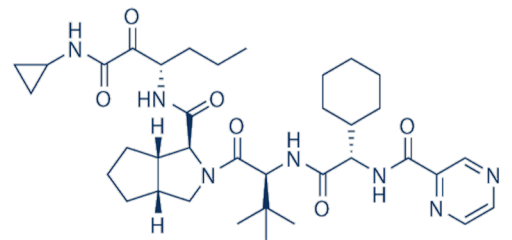
## Telaprevir (HCV Protease抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF4144-10mM	Telaprevir (HCV Protease抑制剂)	10mM×0.2ml
SF4144-5mg	Telaprevir (HCV Protease抑制剂)	5mg
SF4144-25mg	Telaprevir (HCV Protease抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	(3S,3aS,6aR)-2-[(2S)-2-[[[(2S)-2-cyclohexyl-2-(pyrazine-2-carboxylamino)acetyl]amino]-3,3-dimethylbutanoyl]-N-[(3S)-1-(cyclopropylamino)-1,2-dioxohexan-3-yl]-3,3a,4,5,6,6a-hexahydro-1H-cyclopenta[c]pyrrole-3-carboxamide
简称	Telaprevir
别名	VX-950, Incivek, VX 950, Telavic
中文名	特拉匹韦
化学式	C <sub>36</sub> H <sub>53</sub> N <sub>7</sub> O <sub>6</sub>
分子量	679.85
CAS号	402957-28-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 136mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.74ml DMSO, 或每6.80mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF4144-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Telaprevir (VX-950)是一种丙型肝炎病毒(HCV)NS3-4A丝氨酸蛋白酶抑制剂, IC50为0.354μM。				
信号通路	Proteases; Microbiology				
靶点	HCV NS3-4A serine protease	—	—	—	—
IC50	0.35μM	—	—	—	—
体外研究	Telaprevir作用于Con1(基因型 1b)亚基因组HCV复制细胞, 抑制丙型肝炎病毒NS3-4A丝氨酸蛋白酶, 导致病毒多聚蛋白加工受抑制, 且随后使病毒RNA复制, 全部HCV RNA水平和蛋白水平降低, 这种作用存在时间和剂量依赖性。Telaprevir显著促进对HCV RNA复制的抑制, 温育24、48、72和120小时, 则IC50值分别为0.574μM、0.488μM、0.210μM和0.139μM, 这种作用存在时间依赖性。Telaprevir处理HCV复制细胞, 亲本Huh-7和HepG2细胞48小时后, 对细胞没有毒性。17.5μM Telaprevir完全消除复制细胞中HCV RNA, 撤销处理13天后, 没有反弹。Telaprevir和IFN-α联用, 与两种试剂单独使用相比, 适度提高协同作用, 降低HCV RNA复制和抑制耐药突变, 但是没有明显毒性。				
体内研究	Telaprevir按10和25mg/kg剂量, 口服处理小鼠模型, 降低 HCV蛋白酶依赖的裂解和SEAP从肝脏分泌到血液中, 分别降低18.7%和18.4%。Telaprevir按200mg/kg剂量处理基因型1b HCV感染人肝细胞的小鼠1周, 导致HCV RNA降低和MK-0608(50mg/kg)联用处理小鼠, 持续4周, 可完全除去鼠体内病毒。				
临床实验	N/A				
特征	与BILN 2061(一种非共价抑制剂)不一样, Telaprevir是NS3-4A蛋白酶的共价, 可逆抑制剂, 具有结合慢和解离慢的特性。				

#### ➤ 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	含自我复制, 亚基因组HCV复制的稳定Huh-7细胞, 与HCV抗体实验中使用的I377neo/NS3-3'/wt复制一致。复制的细胞和Telaprevir在37°C下按指定时间温育, Telaprevir事先在含2% FBS和0.5% DMSO的DMEM培养基中稀释。使用RNeasy-96试剂盒抽提全部细胞RNA, 使用定量RT-PCR(QRT-PCR)实验测定IC50而测定HCV RNA复制量。

细胞实验	
细胞系	Huh-7, HepG2和外周血单个核细胞(PBMC)
浓度	溶于DMSO, 终浓度为1mM
处理时间	48小时
方法	用不同浓度Telaprevir处理细胞48小时。通过MTS实验测定细胞活力。

动物实验	
动物模型	注射重组腺病毒(Ad-WT-HCVpro-SEAP或Ad-MT-HCVpro-SEAP)的SCID小鼠
配制	在聚乙烯吡咯烷酮(PVP)K-30和2%十二烷基硫酸钠中配制
剂量	300mg/kg
给药方式	口服饲喂

➤ **参考文献:**

- 1.Lin K, et al. Antimicrob Agents Chemother, 2006, 50(5), 1813-1822.
- 2.Perni RB, et al. Antimicrob Agents Chemother, 2006, 50(3), 899-909.
- 3.Ohara E, et al. J Hepatol, 2011, 54(5), 872-878.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SF4144-10mM	Telaprevir (HCV Protease抑制剂)	10mM×0.2ml
SF4144-5mg	Telaprevir (HCV Protease抑制剂)	5mg
SF4144-25mg	Telaprevir (HCV Protease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成高浓度的储备液(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