

## 产品说明书

26 版

## 基本信息

|       |         |
|-------|---------|
| 产品编号: | D10057  |
| 产品名称: | 甲磺酸地拉韦定 |

## 产品简介:

|                                                                                                                                                                              |       |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------|
| 一种有效的 HIV-1 抗病毒和逆转录酶抑制剂。                                                                                                                                                     |       |
| 靶点:                                                                                                                                                                          | HIV-1 |
| 体外研究:                                                                                                                                                                        |       |
| 在 H9 和 PBMC 培养物中, Delavirdine 在浓度 $>100 \mu\text{M}$ 时具有 50% 的细胞毒性。Delavirdine 具有低细胞毒性, 在 $100 \mu\text{M}$ 时导致外周血淋巴细胞活力降低不到 8%。                                             |       |
| Delavirdine 抑制 HIV-1 逆转录酶 (RT) 野生型, $\text{IC}_{50}$ 值为 $0.26 \mu\text{M}$ , 它抑制 Y181C 取代的 RT 和 K103N 取代的 RT, $\text{IC}_{50}$ 值分别为 $8.32 \mu\text{M}$ 和 $7.7 \mu\text{M}$ 。 |       |
| 体内研究:                                                                                                                                                                        |       |
| Delavirdine (U 90152) mesylate (oral gavage; 10 mg/kg, 200 mg/kg, 250 mg/kg; single dose) 吸收和代谢迅速, 构成循环中的次要成分, 其药代动力学呈非线性, 并且在 CD-1 小鼠中其代谢为脱烷基地拉韦定的能力有限或可抑制 (PK 研究)。         |       |

## 使用方法 (供参考):

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |           |           |            |  |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------|-----------|------------|--|
| 一: 体外实验                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |           |           |            |  |
| DMSO: 溶于 DMSO ( $>5 \text{ mg/mL}$ )                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |           |           |            |  |
| 浓度 \ 质量<br>溶液体积                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | 1mg       | 5mg       | 10mg       |  |
| 1 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | 1.8094 mL | 9.0470 mL | 18.0940 mL |  |
| 5 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | 0.3619 mL | 1.8094 mL | 3.6188 mL  |  |
| 10 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | 0.1809 mL | 0.9047 mL | 1.8094 mL  |  |
| 储备液的保存方式: $-80^{\circ}\text{C}$ , 6 months; $-20^{\circ}\text{C}$ , 1 month (sealed storage, away from moisture)。                                                                                                                                                                                                                                                                                |           |           |            |  |
| 二: 体内实验                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |           |           |            |  |
| 1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline<br>Solubility: $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (4.52 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \mu\text{L}$ 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $400 \mu\text{L}$ PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 $50 \mu\text{L}$ Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 $450 \mu\text{L}$ 生理盐水 定容至 1 mL。 |           |           |            |  |
| 2、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE- $\beta$ -CD in Saline)<br>Solubility: $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (4.52 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \mu\text{L}$ 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \mu\text{L}$ 20% 的 SBE- $\beta$ -CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。<br>2 g SBE- $\beta$ -CD (磺丁基醚 $\beta$ -环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。           |           |           |            |  |



3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility:  $\geq 2.5$  mg/mL (4.52 mM); 澄清溶液

此方案可获得  $\geq 2.5$  mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例, 取 100  $\mu$ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900  $\mu$ L 玉米油中, 混合均匀。

4、请依序添加每种溶剂： 0.5% CMC-Na/saline water

Solubility: 5 mg/mL (9.05 mM); 悬浊液; 超声助溶

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

### 注意事项：

1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

**储存：** -20℃

