

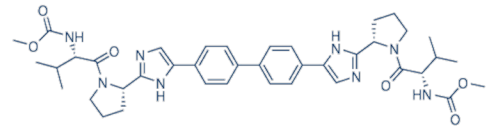
Daclatasvir (HCV NS5A抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF4162-10mM	Daclatasvir (HCV NS5A抑制剂)	10mM×0.2ml
SF4162-5mg	Daclatasvir (HCV NS5A抑制剂)	5mg
SF4162-25mg	Daclatasvir (HCV NS5A抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	methyl N-[(2S)-1-[(2S)-2-[5-[4-[4-[2-[(2S)-1-[(2S)-2-(methoxycarbonylamino)-3-methylbutanoyl]pyrrolidin-2-yl]-1H-imidazol-5-yl]phenyl]phenyl]-1H-imidazol-2-yl]pyrrolidin-1-yl]-3-methyl-1-oxobutan-2-yl]carbamate
简称	Daclatasvir
别名	BMS-790052, CHEBI:82977, BMS 790052
中文名	达卡他韦
化学式	C ₄₀ H ₅₀ N ₈ O ₆
分子量	738.88
CAS号	1009119-64-5
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 148mg/ml; Ethanol 148mg/ml
溶液配制	5mg加入0.68ml DMSO, 或每7.39mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF4162-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Daclatasvir (BMS-790052)是一种高度选择性的HCV NS5A抑制剂, EC ₅₀ 为9-50pM, 在细胞培养中, 作用于多种HCV复制基因型和JFH-1基因型2a的感染性病毒。Phase 3。				
信号通路	Proteases; Microbiology				
靶点	HCV NS5A	—	—	—	—
IC ₅₀	9 pM-50 pM(EC ₅₀)	—	—	—	—
体外研究	BMS-790052是目前为止报道的最有效的HCV复制抑制抑制剂之一, 作用于HCV基因型1a和1b复制子时EC ₅₀ 分别为50和9pM。BMS-790052治疗指数(CC ₅₀ /EC ₅₀)为105以上, 对一组10种RNA和DNA病毒没有作用效果, EC ₅₀ 大于10μM, BMS-790052只针对HCV有效。BMS-790052作用于含HCV基因型1b复制子的Huh7细胞, BMS-790052抑制短暂和稳定的HCV染色体复制, EC ₅₀ 为1-15pM。BMS-790052(100pM或1nM)改变NS5A的亚细胞定位和生化结构。BMS-790052抑制含HCV基因型-4 NS5A基因的杂合复制子, EC ₅₀ 为7-13pM。杂合复制子中的NS5A残基30是BMS-790052选择耐受性的一个重要位点。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	BMS-790052是一流的高选择性C型肝炎病毒(HCV)NS5A抑制抑制剂, EC ₅₀ 为皮摩尔级。				

➤ 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	肽段(Ac-Asp-Glu-Asp [EDANS]-Glu-Glu-Abu-[COO] Ala-Ser-Lys [DABCYL]-NH ₂)含荧光供体{EDANS, 5-[(2-氨基)氨基]萘-1-磺酸}, 位于肽段一端; 受体{DABCYL, 4-[4-(二甲基氨基)苯偶氮]苯甲酸}, 位于肽段另一端。通过在供体和受体之间分子能量共振转移使肽段荧光淬灭, NS3蛋白酶使肽段断裂, 共振能量转移淬灭使产物释放, 供体的荧光随着底物被NS3蛋白酶降解的时间而增强。反应所用试剂如下: 5×荧光素酶细胞培养液用dH ₂ O稀释到1×, NaCl(150mM), FRET肽(20μM)。HCV-Huh-7细胞按每孔1×10 ⁴ 个接种在96孔板上, 粘附过夜。第二天, BMS-790052加到孔中, 温育72小时。用PBS冲洗板, 每孔加入30μl FRET肽实验试剂进行FRET实验。使用Cytofluor 4000仪测定吸光值。随后, 40μl荧光素酶底物加到每孔中, 测定荧光值。

细胞实验	
细胞系	HCV复制子细胞(Huh7)
浓度	0.1pM-50μM, 溶于DMSO, 最终DMSO浓度为0.5%
处理时间	72小时
方法	细胞接种在96孔板上的200μL培养基中, 12小时后, BMS-790052加到含HCV复制子的96孔板上。温育72小时, 测定复制活性和细胞毒性。使用CellTiter-Blue测定细胞毒性。随后, 移除培养基和染料, 使板倒转, 残留的液体用纸巾吸干, 使用Renilla荧光素酶测定HCV基因型1a细胞系的复制活性。1×Renilla荧光素酶溶解buffer (30μl)加到每孔中, 温和震荡15分钟。加入Renilla荧光素酶底物(40μl), 使用Top Count光度计测定信号。

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.Gao M, et al. Nature, 2010, 465(7294), 96-100.
- 2.Lee C, et al. Virology, 2011, 414(1), 10-18.
- 3.Wang C, et al. Antimicrob Agents Chemother, 2012, 56(3), 1588-1590.
- 4.O'Boyle DR 2nd, et al. Antimicrob Agents Chemother, 2005, 49(4), 1346-1353.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF4162-10mM	Daclatasvir (HCV NS5A抑制剂)	10mM×0.2ml
SF4162-5mg	Daclatasvir (HCV NS5A抑制剂)	5mg
SF4162-25mg	Daclatasvir (HCV NS5A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