



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **PF-3450074**
CAS 号: **1352879-65-2**
产品货号: **S87929**

生物活性:

Description	PF-3450074 (PF-74) 是 HIV-1 衣壳蛋白 (HIV-1 CA) 的特异性抑制剂, 对 HIV 分离株表现出广谱抑制作用, 显示出亚微摩尔级别的效价 (EC50=8-640 nM)。PF-3450074 (PF-74) 在 HIV-1 感染的早期阶段起作用, 通过与 CPSF6 和 NUP153 的结合直接竞争来抑制病毒复制, 并阻断病毒生命周期的脱膜, 组装和逆转录步骤。CPSF6: 核宿主因子裂解和聚腺苷酸特异性因子 6; NUP153: 核孔蛋白 153。			
IC50 & Target[1]	HIV-1 (NL4.3 strain) 0.72 μ M (IC50)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	MT4	CC ₅₀	> 70.5 μ M	Cytotoxicity against human MT4 cells assessed as reduction in cell viability after 24 hrs by CytoTox-Glo cytotoxicity assay
	MT4	CC ₅₀	145.18 μ M	Cytotoxicity in mock-infected human MT4 assessed as reduction in cell viability incubated for 5 days by MTT assay
	MT4	CC ₅₀	32.27 μ M	Cytotoxicity against human MT4 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 5 days by MTT assay
	MT4	CC ₅₀	32.27 μ M	Cytotoxicity against mock infected human MT4 cells by MTT assay
	TZM	CC ₅₀	> 23.5 μ M	Cytotoxicity against in human TZM-bl cells assessed as reduction in cell viability measured after 2 days by cell titre glo luminiscent cell viability assay
	TZM	CC ₅₀	> 47 μ M	Cytotoxicity in uninfected human TZM-bl assessed as reduction in cell viability incubated for 1 day by Cyto-tox-Glo cytotoxicity assay
	TZM	CC ₅₀	> 50 μ M	Cytotoxicity against human TZM cells expressing GFP assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by XTT assay
	TZM	CC ₅₀	76 μ M	Cytotoxicity against human TZM-GFP cells incubated for 72 hrs by by XTT assay
In Vitro	PF-3450074 (PF-74) 对 HIV 野生型 NL4-3 和 HIV T107N 突变体具有抗病毒活性, EC50 值分别为 0.72 μM 和 4.5 μM[1]。 PF-3450074 (PF-74) 在原代人外周血单核细胞 (PBMC) 中表现出良好的效力, 抑制 HIV-193RW025、HIV-1JR-CSF 和 HIV-193MW965 与 IC50 值为 1.5 $\pm$ 0.9 μM; 0.6 $\pm$ 0.20 μM 和 0.6 $\pm$ 0.10 μM。该化合物的中值 IC50 和 CC50 值分别为 0.9 $\pm$ 0.5 μM 和 90.5 $\pm$ 5.9 μM[1]。 PF-74 和 CA 六聚体之间相互作用的 KD, 以与 NUP153 相同的方式推导, 确定为 176 $\pm$ 78 nM[1]。 PF-3450074 (PF-74) (10 μM; 8 小时) 可使 HeLa-P4 细胞中经 DNase I 处理的 Env 缺陷型 HIV-1 (R9.Env-) 库存的逆转录晚期产物明显减少[2]。			



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	RT-PCR[2]					
	Cell Line:	HeLa-P4 cells				
	Concentration:	10 μM				
	Incubation Time:	8 hours				
	Result:	Inhibited HIV-1 reverse transcription in target cells.				
Solvent&Solubility	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (587.52 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)					
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	
		1 mM	2.3501 mL	11.7503 mL	23.5007 mL	
		5 mM	0.4700 mL	2.3501 mL	4.7001 mL	
		10 mM	0.2350 mL	1.1750 mL	2.3501 mL	
	*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。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。 -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 6.25 mg/mL (14.69 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 6.25 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 μL 62.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。					
	参考文献	[1]. Xu JP, et al. Exploring Modifications of an HIV-1 Capsid Inhibitor: Design, Synthesis, and Mechanism of Action.J Drug Des Res. 2018;5(2). pii: 1070. Epub 2018 Aug 13.				
		[2]. Shi J, et al. Small-molecule inhibition of human immunodeficiency virus type 1 infection by virus capsid destabilization.J Virol. 2011 Jan;85(1):542-9..				
	完整储备液配制表:					
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。						
储备液的保存方式和期限: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year。 -80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。						
可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg	



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

DMSO	1 mM	2.3501 mL	11.7503 mL	23.5007 mL	58.7516 mL
	5 mM	0.4700 mL	2.3501 mL	4.7001 mL	11.7503 mL
	10 mM	0.2350 mL	1.1750 mL	2.3501 mL	5.8752 mL
	15 mM	0.1567 mL	0.7834 mL	1.5667 mL	3.9168 mL
	20 mM	0.1175 mL	0.5875 mL	1.1750 mL	2.9376 mL
	25 mM	0.0940 mL	0.4700 mL	0.9400 mL	2.3501 mL
	30 mM	0.0783 mL	0.3917 mL	0.7834 mL	1.9584 mL
	40 mM	0.0588 mL	0.2938 mL	0.5875 mL	1.4688 mL
	50 mM	0.0470 mL	0.2350 mL	0.4700 mL	1.1750 mL
	60 mM	0.0392 mL	0.1958 mL	0.3917 mL	0.9792 mL
	80 mM	0.0294 mL	0.1469 mL	0.2938 mL	0.7344 mL
	100 mM	0.0235 mL	0.1175 mL	0.2350 mL	0.5875 mL

源叶