



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: **Obefazimod (Synonyms: ABX464)**

CAS 号: **1258453-75-6**

产品货号: **S88770**

生物活性:

Description	Obefazimod (ABX464) 是一种有效的抗 HIV 剂。Obefazimod 作用于受刺激的外周血单个核细胞 (PBMCs), 抑制 HIV-1 复制, IC ₅₀ 为 0.1 μM 至 0.5 μM。			
IC₅₀ & Target[1]	HIV-1 0.1-0.5 μM (IC ₅₀ , in PBMCs)			
In Vitro	Obefazimod 抑制 PBMC 和巨噬细胞感染细胞中的 HIV-1 产生。Obefazimod 对所有测试的 HIV-1 亚型都有很强的抑制作用, 包括亚型 B、C 和重组病毒。Obefazimod 还可以非常有效地抑制病毒株的复制, 这些病毒株含有在体外对不同处理药物产生耐药性的突变。虽然抗病毒药物 3TC 对 K65R 和 M184V 突变株的活性不高, 但 Obefazimod 可抑制这两种菌株。为了概括 Obefazimod 对其他原代细胞中 HIV-1 复制的影响, 用 0.01 μM 至 30 μM 浓度的 Obefazimod 处理细胞, 并在 12 天的时间内监测培养物上清液中的 p24 抗原水平。Obefazimod 以剂量依赖性方式有效阻断病毒复制, IC ₅₀ 介于 0.1 μM 和 1 μM 之间[1].			
In Vivo	用人淋巴细胞重建的人源化小鼠提供了快速、可靠、可重复的实验系统, 用于测试 Obefazimod 的体内疗效。在初始设置中, SCID 小鼠用 PBMC 重建, 然后感染 HIV-1 菌株 JR-CSF。通过用 20 mg/kg 的 Obefazimod 口服强饲法每天两次 (bid) 处理小鼠, 持续 15 天。病毒 RNA 的测量表明, 在 15 天的处理期间, 使用 Obefazimod 进行口服处理能够显著降低病毒载量。血液样本的 FACS 分析表明, 用 Obefazimod 处理可防止重组小鼠感染后 CD4 ⁺ 细胞的耗竭, 从而恢复 CD8 ⁺ /CD4 ⁺ 与未感染小鼠的比率[1].			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (295.24 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.9524 mL	14.7619 mL
		5 mM	0.5905 mL	2.9524 mL
		10 mM	0.2952 mL	1.4762 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, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline			



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: shyyysw@sina.com

	Solubility: ≥ 3.75 mg/mL (11.07 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3.75 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 37.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 3.75 mg/mL (11.07 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3.75 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 37.5 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]. Campos N, et al. Long lasting control of viral rebound with a new drug ABX464 targeting Rev-mediated viral RNA biogenesis. Retrovirology. 2015 Apr 9;12:30.

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, 6 months; -20° C, 1 month. -80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.9524 mL	14.7619 mL	29.5238 mL	73.8095 mL
	5 mM	0.5905 mL	2.9524 mL	5.9048 mL	14.7619 mL
	10 mM	0.2952 mL	1.4762 mL	2.9524 mL	7.3809 mL
	15 mM	0.1968 mL	0.9841 mL	1.9683 mL	4.9206 mL
	20 mM	0.1476 mL	0.7381 mL	1.4762 mL	3.6905 mL
	25 mM	0.1181 mL	0.5905 mL	1.1810 mL	2.9524 mL
	30 mM	0.0984 mL	0.4921 mL	0.9841 mL	2.4603 mL
	40 mM	0.0738 mL	0.3690 mL	0.7381 mL	1.8452 mL
	50 mM	0.0590 mL	0.2952 mL	0.5905 mL	1.4762 mL
	60 mM	0.0492 mL	0.2460 mL	0.4921 mL	1.2302 mL
	80 mM	0.0369 mL	0.1845 mL	0.3690 mL	0.9226 mL
	100 mM	0.0295 mL	0.1476 mL	0.2952 mL	0.7381 mL