



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: shyysw@sina.com

产品名称: **NVR 3-778**
CAS 号: **1445790-55-5**
产品货号: **S89248**

生物活性:				
Description	NVR 3-778 是一种首创、口服有效的 HBV CAM (衣壳组装调制剂),属于 SBA 类,具有抗 HBV 活性。			
IC50 & Target	HBV[1].			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HepG2 2.2.15	CC ₅₀	15.3 μM	Cytotoxicity against human HepG2.2.15 cells assessed as reduction in cell viability
	HepG2 2.2.15	CC ₅₀	15.3 μM	Cytotoxicity against human HepG2.2.15 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 3 days followed by replacement of fresh medium containing compound and measured after 3 days by cell titer glo-based luminescence assay
	HepG2 2.2.15	CC ₅₀	4.81 μM	Cytotoxicity against human HepG2.2.15 cells
	HepG2 2.2.15	CC ₅₀	8.6 μM	Cytotoxicity against human HepG2 2.2.15 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 5 days by MTT assay
	HepG2 2.2.15	IC ₅₀	0.26 μM	Antiviral activity against Hepatitis B virus infected in human HepG2.2.15 cells by solid phase radioimmunoassay
In Vitro	NVR 3-778 以 HBV 核心蛋白为靶点并抑制病毒复制[1]。 NVR 3-778 在 HepG2.2.15 细胞中,抑制含有 HBV DNA 的传染性病毒颗粒的产生,平均抗病毒作用的 EC50 of 0.40 μM[1]。 NVR 3-778 具有全基因型抗病毒活性,且与 (t) HBV 复制的核苷抑制剂无交叉耐药性[1]。 NVR 3-778 抑制前基因组 RNA 包壳、病毒复制以及含有 HBV DNA 和 HBV RNA 的颗粒的产生[1]。 NVR 3-778 还抑制原代人肝细胞中的从头感染和病毒复制,对 HBV DNA EC50 为 0.81 μM,抑制 HBV 抗原和细胞内 HBV RNA 的产生为 3.7 μM-4.8 μM[1]。 NVR 3-778 在 10%、20% 和 40% 人血清中的 EC50 值分别增加 4.5-, 9.3 -, 和 15.8 倍[1]。			
	In Vivo	NVR 3-778 (1.5 mg/kg; ig) 在狗中显示平均 Cmax 和 AUC0-inf 值分别为 0.56 μg/mL 和 3.50 μg • h/mL。经测定,平均口服生物利用度为 84.6%[1]。		
		Animal Model:	Dogs[1]	
		Dosage:	1.5 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)	
		Administration:	Oral gavage	
	Result:	The mean Cmax and AUC0-inf values are 0.56 μg/ml and 3.50 μg•h/ml and the oral bioavailability is 84.6%.		
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (578.18 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)			
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg 10 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: shyysw@sina.com

	Preparing	1 mM	2.3127 mL	11.5636 mL	23.1273 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4625 mL	2.3127 mL	4.6255 mL
		10 mM	0.2313 mL	1.1564 mL	2.3127 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 Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.81 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (4.81 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-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。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.81 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Lam AM, et al. Preclinical Characterization of NVR 3-778, a First-in-Class Capsid Assembly Modulator against Hepatitis B Virus. Antimicrob Agents Chemother. 2018 Dec 21;63(1).				

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。



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3127 mL	11.5636 mL	23.1273 mL	57.8182 mL
	5 mM	0.4625 mL	2.3127 mL	4.6255 mL	11.5636 mL
	10 mM	0.2313 mL	1.1564 mL	2.3127 mL	5.7818 mL
	15 mM	0.1542 mL	0.7709 mL	1.5418 mL	3.8545 mL
	20 mM	0.1156 mL	0.5782 mL	1.1564 mL	2.8909 mL
	25 mM	0.0925 mL	0.4625 mL	0.9251 mL	2.3127 mL
	30 mM	0.0771 mL	0.3855 mL	0.7709 mL	1.9273 mL
	40 mM	0.0578 mL	0.2891 mL	0.5782 mL	1.4455 mL
	50 mM	0.0463 mL	0.2313 mL	0.4625 mL	1.1564 mL
	60 mM	0.0385 mL	0.1927 mL	0.3855 mL	0.9636 mL
	80 mM	0.0289 mL	0.1445 mL	0.2891 mL	0.7227 mL
	100 mM	0.0231 mL	0.1156 mL	0.2313 mL	0.5782 mL

源叶