



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: **Gardiquimod**
CAS 号: **1020412-43-4**
产品货号: **S89519**

生物活性:

Description	Gardiquimod 是一种咪唑啉类 TLR7/8 激动剂。Gardiquimod 可抑制巨噬细胞和活化外周血单个核细胞 (PBMCs) 的 HIV-1 感染。当浓度低于 10 μM 时, Gardiquimod 可以特异性激活 TLR7。				
IC50 & Target[1]	TLR7	TLR8	HIV-1		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	EC ₅₀	2 μM	Agonist activity at human TLR7 expressed in NF-kappaB-stimulated HEK293 cells assessed as induction of secreted alkaline phosphatase expression by reporter gene assay	
In Vitro	Gardiquimod (6-60 μM) significantly inhibits cDNA synthesis by HIV-1 reverse transcriptase[1]。				
In Vivo	Dendritic cells (DCs) in combination with Gardiquimod (1 mg/kg per mouse; i.p.; daily for 7 days) improves the anti-tumor effects of NK cells[2]。				
	Animal Model:		Male athymic nude mice (Balb-nu/nu, 5 weeks old) (bearing human HepG2 liver carcinoma xenografts)[2]		
	Dosage:		1 mg/kg per mouse		
	Administration:		i.p.; daily for 7 days		
	Result:		Significantly suppressed the growth of human HepG2 liver carcinoma xenografts		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (319.08 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	3.1908 mL	15.9541 mL	31.9081 mL
		5 mM	0.6382 mL	3.1908 mL	6.3816 mL
		10 mM	0.3191 mL	1.5954 mL	3.1908 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: ≥ 2.5 mg/mL (7.98 mM); 澄清溶液					
此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。					
以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.98 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.98 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 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 μL 25.0 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]. Buitendijk M, et al. Gardiquimod: a Toll-like receptor-7 agonist that inhibits HIV type 1 infection of human macrophages and activated T cells. AIDS Res Hum Retroviruses. 2013 Jun;29(6):907-18. [2]. Zhou Z, et al. TLR7/8 agonists promote NK-DC cross-talk to enhance NK cell anti-tumor effects in hepatocellular carcinoma. Cancer Lett. 2015 Dec 28;369(2):298-306.

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 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month。 -80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ 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	3.1908 mL	15.9541 mL	31.9081 mL	79.7703 mL
	5 mM	0.6382 mL	3.1908 mL	6.3816 mL	15.9541 mL
	10 mM	0.3191 mL	1.5954 mL	3.1908 mL	7.9770 mL
	15 mM	0.2127 mL	1.0636 mL	2.1272 mL	5.3180 mL
	20 mM	0.1595 mL	0.7977 mL	1.5954 mL	3.9885 mL
	25 mM	0.1276 mL	0.6382 mL	1.2763 mL	3.1908 mL
	30 mM	0.1064 mL	0.5318 mL	1.0636 mL	2.6590 mL
	40 mM	0.0798 mL	0.3989 mL	0.7977 mL	1.9943 mL



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

	50 mM	0.0638 mL	0.3191 mL	0.6382 mL	1.5954 mL
	60 mM	0.0532 mL	0.2659 mL	0.5318 mL	1.3295 mL
	80 mM	0.0399 mL	0.1994 mL	0.3989 mL	0.9971 mL
	100 mM	0.0319 mL	0.1595 mL	0.3191 mL	0.7977 mL



源叶