碧云天生物技术/Beyotime Biotechnology
订货热线：400-1683301或800-8283301
订货e-mail：order@beyotime.com
技术咨询：info@beyotime.com
网址：http://www.beyotime.com

碧云天网站 微信公众号

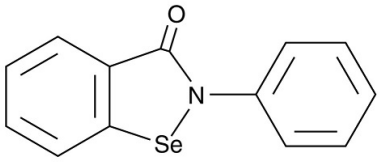
Ebselen (HIV-1抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF1190-10mM	Ebselen (HIV-1抑制剂)	10mM
SF1190-5mg	Ebselen (HIV-1抑制剂)	5mg
SF1190-25mg	Ebselen (HIV-1抑制剂)	25mg
SF1190-100mg	Ebselen (HIV-1抑制剂)	100mg

产品简介：

➢ **化学信息：**

化学名	2-Phenyl-1,2-benzisoselenazol-3(2H)-one
简称	SPI-1005, PZ-51, CCG-39161, DR-3305
别名	Ebselen, Ebselene, Ebseleno, Ebselenum, Harmokisane
中文名	依布硒；依布硒啉
化学式	$C_{13}H_9NOSe$
分子量	274.18
CAS号	60940-34-3
纯度	>98%
溶剂/溶解度	DMSO 50mg/ml, need ultrasonic; Water insoluble; Ethanol insoluble
溶液配制	2mg 加入 0.729ml DMSO，或者每 2.742mg 加入 1ml DMSO，配制成10mM溶液。



➢ **生物信息:**

产品描述	Ebselen是一种有机硒化合物，可以有效阻断电压依赖性钙通道(VDCC)；抑制HIV-1衣壳蛋白的复制；作为一种谷胱甘肽过氧化物酶模拟物，还具有清除过氧亚硝基的作用。Ebselen可透过血脑屏障，具有抗炎、抗氧化、抗肿瘤和抗病毒活性，是FDA批准的新型抗炎药，在预防和治疗听力损失的方面有很大的潜力。在动物和人体实验中还发现Ebselen可以缓解烦躁的情绪、抗抑郁。研究表明，Ebselen对新型冠状肺炎COVID-19病毒的关键药物靶点Main protease (M^{pro})蛋白酶具有很强的抑制作用。				
信号通路	Anti-infection; Neuronal Signaling; Membrane Transporter/Ion Channel; Metabolic Enzyme/Protease				
靶点	M^{pro}	COVID-19	HIV-1	Phosphatase	Calcium Channel
IC50/EC50	0.67μM	4.67μM	46.1nM	-	-
体外研究	Ebselen是HIV-1复制过程中衣壳蛋白的小分子抑制剂，主要通过抑制衣壳蛋白两个α螺旋折叠区域中的C端结构域(CTD)的二聚化使HIV-1丧失感染宿主细胞的能力；Ebselen具有抗肿瘤作用，可以通过抑制静息巯基氧化酶-1 (Quiescin sulfhydryl oxidase 1, QSOX1)降低胰腺癌和肾癌细胞的侵袭；在COVID-19病毒感染的Vero细胞中，Ebselen抑制了COVID-19病毒关键药物靶点M^{pro}，EC50为4.67μM。				
体内研究	在C57BL/6小鼠模型中，肌醇单磷酸酶(Inositol monophosphatase, IMPase)抑制剂Ebselen (5mg/kg; i.p.)以类似于锂(lithium)的机制在皮质和海马区增加了神经元可塑性基因的表达。腹腔注射CdCl2致睾丸损伤的小鼠模型显示，Ebselen降低了小鼠的氧化应激反应。				
临床实验	关于Ebselen是否有助于情绪处理的双盲、随机、交叉设计试验共有20名健康的受试者(7名女性，13名男性)参与。研究表明，服用Ebselen (3600mg over 24h)可以降低受试者的冲动性，缓解烦躁情绪，使受试者在情绪处理的时候更倾向于积极的一面。在关于Ebselen治疗梅尼埃病的临床II期研究中。149名患有活动性梅尼埃病的受试者口服安慰剂、200或400mg Ebselen 28天，每天2次。试验结果显示服用Ebselen的受试患者的听力有65%到95%的改善。另外，亦有以Ebselen为脑梗塞急性期治疗药的临床试验开展。				
特征	Ebselen具有广泛的治疗作用，包括抗病毒、抗炎、抗氧化、抗抑郁等。				

➢ **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	N/A

细胞实验	
细胞系	MIAPaCa-2、BXPC3、786-O、UOK117细胞
浓度	5, 10, 15μM
处理时间	20h
方法	胰酶消化对数生长期的细胞，用培养基重悬后计数。将细胞稀释到适宜的密度后转移入Matrigel侵袭小室，分别加入不同浓度的Ebselen (5、10、15μM)进行孵育。20小时后对侵袭细胞数进行定量检测。

动物实验	
动物模型	C57BL/6小鼠
配制	用DMSO溶解后再用玉米油稀释
剂量	5mg/kg
给药方式	i.p.

➢ **参考文献：**

1. Jin Z, et al. Structure of Mpro from COVID-19 virus and discovery of its inhibitors. Nature. 2020 Apr 9.
2. Antoniadou I, et al. Effect of lithium and ebselen, a novel inhibitor of inositol monophosphatase, on molecular markers of neuronal plasticity in the mouse. British pharmacological society, winter meeting (2013). 2013.
3. Masaki C, et al. Effects of the potential lithium-mimetic, ebselen, on impulsivity and emotional processing. Psychopharmacology, 2016, 233(14).
4. Masaki C, et al. Effects of the potential lithium-mimetic, ebselen, on brain neurochemistry: a magnetic resonance spectroscopy study at 7 tesla. Psychopharmacology, 2016, 233(6):1097-1104.
5. Thenin-Houssier S, et al. Ebselen, a Small-Molecule Capsid Inhibitor of HIV-1 Replication. Antimicrob Agents Chemother. 2016 Mar 25;60(4):2195-208.
6. Hanavan P D, et al. Ebselen inhibits QSOX1 enzymatic activity and suppresses invasion of pancreatic and renal cancer cell lines. Oncotarget. 2015 Jul 30;6(21):18418-28.
7. Kil J, et al. Ebselen treatment reduces noise induced hearing loss via the mimicry and induction of glutathione peroxidase. Hearing research, 2007, 226(1-2):0-51.

包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SF1190-10mM	Ebselen (HIV-1抑制剂)	10mM×0.2ml
SF1190-5mg	Ebselen (HIV-1抑制剂)	5mg
SF1190-25mg	Ebselen (HIV-1抑制剂)	25mg
SF1190-100mg	Ebselen (HIV-1抑制剂)	100mg
—	说明书	1份

保存条件：

-20ºC保存，至少一年有效。5mg、25mg和100mg包装也可室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80ºC保存，预计6个月内有效。

注意事项：

➢ 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2,000-10,000×g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降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成高浓度的储备液(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、体内研究结果或其它相关文献，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 2020.04.23