

阿扎那韦硫酸盐 ; Atazanavir sulfate

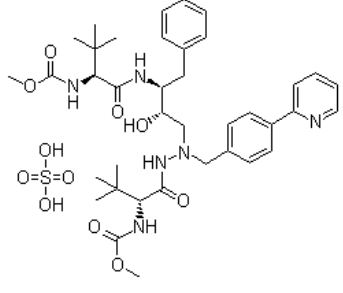
产品编号 : MB1749

质量标准 : >99%,BR

包装规格 : 200MG ; 1 G ;

产品形式 : 结晶性粉末

基本信息

分子式	C38H52N6O7.H2SO4	结 构 式	
分子量	802.93		
CAS No.	229975-97-7		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 104 mg/mL (129.52 mM) Water Insoluble Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介 : 硫酸阿扎那韦 Atazanavir 硫酸盐是 HIV-1 蛋白酶高活性抑制剂。

别名 : BMS-232632 sulfate ; BMS-232632-05;阿扎那韦硫酸盐 ;

3-dimethyl-1-oxobutan-2-yl]carbamate sulfate

物理性状及指标 :

外观 :白色或类白色粉末

溶解性 :DMSO 104 mg/mL (129.52 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

干燥失重 :≤1.0%

含量 :>99%

储存条件 : 常温, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Atazanavir Sulfate 是一种 HIV protease 抑制剂, 无细胞试验中 K_i 值为 2.66 nM。		
特性	Atazanavir 比其他 HIV-1 Prt 抑制剂效果更好, 包括 IDV, SQV, RTV, NFV, 和 APV。		
靶点	<table border="1"> <tr> <td>HIV protease (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>2.66 nM(K_i)</td> </tr> </table>	HIV protease (Cell-free assay)	2.66 nM(K_i)
HIV protease (Cell-free assay)			
2.66 nM(K_i)			
体外研究	Atazanavir 作用于病毒感染的 H9 细胞, 抑制病毒 gag 前体 p55 聚合蛋白的蛋白水解裂解, IC_{50} 为~47 nM。Atazanavir 作用于 RF/MT-2 株, 具有有效的抗病毒活性, EC_{50} 为 3.89 nM。Atazanavir 也是 Bilirubin 葡萄糖醛酸化的抑制剂, IC_{50} 为 2.4 μ M。Atazanavir 抑制重组 UGT1A1, K_i 为 1.9 μ M。Atazanavir 抑制 U251, T98G, 和 LN229 胶质母细胞瘤细胞系的细胞生长, 惊人地提高 GRP78 和 CHOP 蛋白水平。Atazanavir 作用于 U251 胶质瘤细胞, 显著增加各种不同大小的多聚泛素化蛋白质。Atazanavir 也抑制人类 20S proteasome		

	蛋白酶体, IC50 为 26 μ M。Atazanavir (30 μ M)作用于 HepG2 细胞, 改变内质网应激的幅度和 UPR 基因表达。Atazanavir (30 mM)作用于 LS180V 细胞, 免疫反应的 P-gp 表达提高 2.5 倍, 细胞内 Rh123 降低。
--	---

美仑相关产品推荐

MB1749-S	阿扎那韦硫酸盐(标准品)
MB1391	阿扎那韦
MB25545	阿扎那韦-d5
MB25544	阿扎那韦-标记 d4
MB1391-S	阿扎那韦 (标准品)

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。阿扎那韦是一种氮杂肽类 HIV-1 蛋白酶抑制剂。本品选择性抑制 HIV-1 感染细胞中病毒 Gag 和 Gag-Pol 多聚蛋白的特定加工过程, 从而阻断成熟病毒的形成。体外抗病毒活性: 阿扎那韦在不含人类血清条件下, 对大量寄植于外周血单核细胞、巨噬细胞、CEM-SS 细胞和 MT2 细胞的实验室和临床分离 HIV-1 病毒株的平均 50%抑制浓度 (IC50) 为 2~5nM。

储液配置:

体 DMSO 浓度	质量 / 体积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.2454 mL	6.2272 mL	12.4544 mL
5 mM	0.2491 mL	1.2454 mL	2.4909 mL
10 mM	0.1245 mL	0.6227 mL	1.2454 mL
50 mM	0.0249 mL	0.1245 mL	0.2491 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>蛋白酶检测:</p> <p>为了测定每种 Prt 抑制剂的抑制常数(K_i), 纯化的 HIV-1RF 野生型 Prt (2.5 nM)与 1 μM 到 15 μM 荧光底物在反应 buffer(1 M NaCl,1 mM EDTA,0.1 M 醋酸钠 [pH 5.5], 0.1% PEG-8000) 中有或无 Atazanavir 存在时在 37°C 下温育。使用 Cytofluor 4000 在 340 nM 处激发后在 490 nM 处测量发射荧光的增加量, 而量化裂解的底物。使用 1.36 μM, 1.66 μM, 2.1 μM, 3.0 μM, 5.0 μM, 或 15 μM 底物在五种浓度 Atazanavir (1.25 nM 到 25 nM)存在时进行反应。对底物裂解进行监测, 每隔 5 分钟监测一次, 持续 30 分钟。通过米氏图的斜率测定在反应早期每种样品的裂解率和 K_i 值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: RF/MT-2 株</p> <p>Concentrations: 15 nM</p> <p>Incubation Time: 6 天</p> <p>Method: 为了测定细胞毒性, 在有连续稀释的 Atazanavir 存在时, 宿主细胞温育 6 天, 使用 XTT 法测量细胞存活率, 计算 50%细胞毒性浓度 (CC50s)。为了评估人类血清蛋白的抗病毒活性效果, 实验中通常使用的 10%胎牛血清替换为 40%成年人血清或 1 mgα1-酸性糖蛋白/mL。</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。

•部分产品我司仅提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

参考文献

- [1] Robinson BS, et al. Antimicrob Agents Chemother, 2000, 44(8), 2093-2099.
- [2] Zhang D, et al. Drug Metab Dispos, 2005, 33(11), 1729-1739.
- [3] Pyrko P, et al. Cancer Res, 2007, 67(22), 10920-10928.
- [4] Parker RA, et al. Mol Pharmacol, 2005, 67(6), 1909-1919.
- [5] Perloff ES, et al. Drug Metab Dispos, 2005, 33(6), 764-770.

活性化合物操作注意事项

1 产品分类：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
> 1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置于干燥器中保存。