



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: **Atazanavir Sulfate**
CAS 号: **229975-97-7**
产品货号: **S44802**

生物活性:	
Description	Atazanavir (BMS-232632) sulfate 是一种高度选择性和口服活性的 HIV-1 蛋白酶抑制剂 (HIV-1 protease)。Atazanavir sulfate 是 CYP3A4 的底物和抑制剂, 也是 P-糖蛋白 (P-glycoprotein (P-gp).) 的抑制剂。Atazanavir sulfate 也是一种严重急性呼吸系统综合征冠状病毒 3CL 前体 (SARS-CoV 3CLpro) 抑制剂, 其 IC50 为 3.49 μ M。Atazanavir sulfate 抑制心脏纤维化、高脂血症并诱导恶性胶质瘤死亡。
IC50 & Target	CYP3 HIV-1
In Vitro	Atazanavir (1-10 μ M, 72 h) 通过调节 HMGB1/TLR9 通路减轻缺氧诱导的大鼠心脏成纤维细胞 (rCFs) 增殖[4]。
	Atazanavir (1-10 μ M, 72 h) 抑制大鼠心脏成纤维细胞中 collagen I, collagen III, HMGB1, p-I κ B α 和 p-NF- κ B 的表达 [4]。
	Atazanavir (1-10 μ M, 48 h) 抑制 A, U251, T98G, LN229 细胞生长并且诱导 U251, T98G, LN229 细胞内质网应激[6]。
	Atazanavir (6.0 μ M) 引发了 C2C12 骨骼肌管细胞的 Ca ²⁺ 瞬变和质膜起泡[7]。
	Cell Proliferation Assay[4]
	Cell Line: Rat cardiac fibroblasts (rCFs)
	Concentration: 0, 1, 3, 10 μ M
	Incubation Time: 72 h
	Result: Inhibited rCFs proliferation in a concentration-dependent manner.
	Western Blot Analysis[4]
	Cell Line: Rat cardiac fibroblasts (rCFs)
	Concentration: 0, 1, 3, 10 μ M
	Incubation Time: 72 h
	Result: Reduced collagen I and collagen III levels in a concentration-dependent manner. Inhibited HMGB1, p-I κ B α and p-NF- κ B expression.
	Cell Viability Assay[6]
	Cell Line: A, U251, T98G, LN229 glioblastoma cell
	Concentration: 0, 12, 25, 50, 75, 100 μ M
	Incubation Time: 48 h
	Result: Reduced cell growth and survival.
	Western Blot Analysis[6]
	Cell Line: U251, T98G, and LN229 glioblastoma cell lines
	Concentration: 0, 12, 25, 50, 75, 100 μ M
	Incubation Time: 48 h



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

	Result:	Increased GRP78 and CHOP protein levels dose-dependently and activated caspase-4 in all cell lines.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 166 mg/mL (206.74 mM; 超声加热助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) H2O 中的溶解度 : < 0.1 mg/mL (insoluble)				
	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	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
*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 (sealed storage, away from moisture)。-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 (3.11 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.11 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 生理盐水电溶液 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: ≥ 2.5 mg/mL (3.11 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。 方案 四 请依序添加每种溶剂: 5% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 50% Saline Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (3.11 mM); 澄清溶液 方案 五 请依序添加每种溶剂: 5% DMSO $\rightarrow$ 95% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (3.11 mM); 澄清溶液。				
参考文献	[1]. Havlir DV, et al. Atazanavir: new option for treatment of HIV infection. Clin Infect Dis. 2004 Jun 1;38(11):1599-604. [2]. Wood R. Atazanavir: its role in HIV treatment. Expert Rev Anti Infect Ther. 2008 Dec;6(6):785-96. [3]. Qi Sun, et al. Bardoxolone and bardoxolone methyl, two Nrf2 activators in clinical trials, inhibit SARS-CoV-2 replication and its 3C-like protease. Signal Transduct Target Ther. 2021 May 29;6(1):212. [4]. Zhang G, et al. Long-term oral atazanavir attenuates myocardial infarction-induced cardiac fibrosis. Eur J Pharmacol. 2018 Jun 5;828:97-102. [5]. Fukushima K, et al. Effect of serum lipids on the pharmacokinetics of atazanavir in hyperlipidemic rats. Biomed Pharmacother. 2009 Nov;63(9):635-42. [6]. Pyrko P, et al. HIV-1 protease inhibitors nelfinavir and atazanavir induce malignant glioma death by triggering endoplasmic reticulum stress. Cancer Res. 2007 Nov 15;67(22):10920-8. [7]. Alomar FA, et al. Efavirenz, atazanavir, and ritonavir disrupt sarcoplasmic reticulum Ca²⁺ homeostasis in skeletal muscles. Antiviral Res. 2021 Mar;187:104975. [8]. Robillard KR, et al. Role of P-glycoprotein in the distribution of the HIV protease inhibitor atazanavir in the brain and male genital tract. Antimicrob Agents Chemother. 2014;58(3):1713-22.				
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 (sealed storage, away from moisture)。-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	1.2454 mL	6.2272 mL	12.4544 mL	31.1360 mL
	5 mM	0.2491 mL	1.2454 mL	2.4909 mL	6.2272 mL
	10 mM	0.1245 mL	0.6227 mL	1.2454 mL	3.1136 mL
	15 mM	0.0830 mL	0.4151 mL	0.8303 mL	2.0757 mL
	20 mM	0.0623 mL	0.3114 mL	0.6227 mL	1.5568 mL
	25 mM	0.0498 mL	0.2491 mL	0.4982 mL	1.2454 mL
	30 mM	0.0415 mL	0.2076 mL	0.4151 mL	1.0379 mL
	40 mM	0.0311 mL	0.1557 mL	0.3114 mL	0.7784 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: shyyssw@sina.com

	50 mM	0.0249 mL	0.1245 mL	0.2491 mL	0.6227 mL
	60 mM	0.0208 mL	0.1038 mL	0.2076 mL	0.5189 mL
	80 mM	0.0156 mL	0.0778 mL	0.1557 mL	0.3892 mL
	100 mM	0.0125 mL	0.0623 mL	0.1245 mL	0.3114 mL



源叶