



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: **NELFINAVIR**
CAS 号: **159989-64-7**
产品货号: **S83672**

生物活性:	
Description	Nelfinavir (AG-1341) 是一种有效的口服生物可利用的 HIV-1 蛋白酶抑制剂 ($K_i=2$ nM) 用于 HIV 感染。Nelfinavir (AG-1341) 是一种广谱的抗癌剂[1][2][3]。
IC50 & Target[3]	HIV-1
In Vitro	Nelfinavir (AG1341) (1-10 μ M; 48 小时) 抑制多发性骨髓瘤细胞的增殖[4]。
	Nelfinavir 抑制 26S 胰凝乳蛋白酶样蛋白酶体活性, 损害增殖并触发细胞凋亡骨髓瘤细胞系和新鲜浆细胞[4]。
	Nelfinavir (1-10 μ M; 17 小时) 诱导多发性骨髓瘤细胞系凋亡[4]。
	Nelfinavir (5 μ M; 0-24 小时) 降低 AKT 的磷酸化[4]。
	Nelfinavir 激活 caspase-3 的裂解, 降低 AKT 的磷酸化, STAT-3、ERK1/2, 并激活未折叠蛋白反应系统的促凋亡通路[4]。
	Cell Proliferation Assay[4]
	Cell Line: RPMI, LP1, U266, OPM2 and MM1S cells
	Concentration: 1, 2, 5, 10 μ M
	Incubation Time: 48 hours
	Result: Inhibited the proliferation of RPMI, LP1, U266, OPM2 and MM1S cell lines in a dose-dependent manner with an IC50 of 1-5 μ M.
	Apoptosis Analysis[4]
	Cell Line: LP1 and U266 cells
	Concentration: 1-10 μ M
	Incubation Time: 17 hours
	Result: Induced a dose-dependent increase in the percentage of annexin V+/propidium iodide+ cells.
	Western Blot Analysis[4]
	Cell Line: U266 cells
	Concentration: 5 μ M
	Incubation Time: 0-24 hours
	Result: The level of AKT phosphorylation in U266 cells decreased.
In Vivo	Nelfinavir (AG1341) (75 mg/kg; 腹腔注射; 每周 5 天, 持续 21 天) 减少 NOD/SCID 小鼠的多发性骨髓瘤细胞生长[4]。
	Animal Model: NOD/SCID mice (bearing U266-luc cells)[4]
	Dosage: 75 mg/kg
	Administration: I.p.; 5 days a week for 21 days
	Result: Decreased MM cell growth in NOD/SCID mice.
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (176.12 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * " $\geq$ " means soluble, but saturation unknown



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

	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.7612 mL	8.8062 mL	17.6125 mL
		5 mM	0.3522 mL	1.7612 mL	3.5225 mL
		10 mM	0.1761 mL	0.8806 mL	1.7612 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℃, 1 year; -20℃, 6 months。-80℃ 储存时，请在 1 年内使用， -20℃ 储存时，请在 6 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 (4.40 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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.40 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。 以下溶解方案，请直接配制工作液。建议现用现配，在短期内尽快用完。 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： 17% Solutol HS-15 in Saline Solubility: 15.15 mg/mL (26.68 mM); 悬浊液; 超声助溶。					
参考文献 [1]. Mondal D, et al. Nelfinavir suppresses signaling and nitric oxide production by human aortic endothelial cells: protective effects of thiazolidinediones. Ochsner J. 2013 Spring;13(1):76-90. [2]. Gills JJ, et al. Nelfinavir, A lead HIV protease inhibitor, is a broad-spectrum, anticancer agent that induces endoplasmic reticulum stress, autophagy, and apoptosis in vitro and in vivo. Clin Cancer Res. 2007 Sep 1;13(17):5183-94. [3]. Kaldor SW, et al. Nelfinavir mesylate (AG1343): a potent, orally bioavailable inhibitor of HIV-1					



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

protease. J Med Chem. 1997 Nov 21;40(24):3979-85.
[4]. Bono C, et al. The human immunodeficiency virus-1 protease inhibitor nelfinavir impairs proteasome activity and inhibits the proliferation of multiple myeloma cells in vitro and in vivo. Haematologica. 2012;97(7):1101 - 1109.
[5]. 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.

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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时,请在 1 年内使用, -20°C 储存时,请在 6 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	1.7612 mL	8.8062 mL	17.6125 mL	44.0311 mL
	5 mM	0.3522 mL	1.7612 mL	3.5225 mL	8.8062 mL
	10 mM	0.1761 mL	0.8806 mL	1.7612 mL	4.4031 mL
	15 mM	0.1174 mL	0.5871 mL	1.1742 mL	2.9354 mL
	20 mM	0.0881 mL	0.4403 mL	0.8806 mL	2.2016 mL
	25 mM	0.0704 mL	0.3522 mL	0.7045 mL	1.7612 mL
	30 mM	0.0587 mL	0.2935 mL	0.5871 mL	1.4677 mL
	40 mM	0.0440 mL	0.2202 mL	0.4403 mL	1.1008 mL
	50 mM	0.0352 mL	0.1761 mL	0.3522 mL	0.8806 mL
	60 mM	0.0294 mL	0.1468 mL	0.2935 mL	0.7339 mL
	80 mM	0.0220 mL	0.1101 mL	0.2202 mL	0.5504 mL
	100 mM	0.0176 mL	0.0881 mL	0.1761 mL	0.4403 mL