

产品名称：沙奎拉韦

产品别名：**Saquinavir Mesylate**；沙奎那韦甲磺酸盐

生物活性：

Description

Saquinavir mesylate is an HIV Protease Inhibitor used in antiretroviral therapy. IC50 Value: Target: HIV Protease Saquinavir is a protease inhibitor. Proteases are enzymes that cleave protein molecules into smaller fragments. HIV protease is vital for both viral replication within the cell and release of mature viral particles from an infected cell. Saquinavir binds to the active site of the viral protease and prevents cleavage of viral polyproteins, preventing maturation of the virus. Saquinavir inhibits both HIV-1 and HIV-2 proteases. Studies have also looked at Saquinavir as a possible anti-cancer agent.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : 20 mg/mL (26.08 mM; Need ultrasonic)

	Solvent	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
	Concentration				
Preparing	1 mM		1.3039 mL	6.5193 mL	13.0387 mL
Stock Solutions	5 mM		0.2608 mL	1.3039 mL	2.6077 mL
	10 mM		0.1304 mL	0.6519 mL	1.3039 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℃，6 months；-20℃，1 month。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2 mg/mL (2.61 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2 mg/mL (2.61 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)

Solubility: ≥ 2 mg/mL (2.61 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2 mg/mL (2.61 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.0 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。

3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil

Solubility: ≥ 2 mg/mL (2.61 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2 mg/mL (2.61 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。

References	<p>[1]. <u>Kaldor et al (1995) Isophthalic acid derivatives: amino acid surrogates for the inhibition of HIV-1 protease. Bioorg.Med.Chem.Lett. 5 721.</u></p> <p>[2]. <u>Yerino GA, Halabe EK, Zini E, Feleder EC. Bioequivalence study of two oral tablet formulations containing saquinavir mesylate boosted with ritonavir in healthy male subjects. Arzneimittelforschung. 2011;61(8):481-7.</u></p> <p>[3]. <u>Branham ML, Moyo T, Govender T. Preparation and solid-state characterization of ball milled saquinavir mesylate for solubility enhancement. Eur J Pharm Biopharm. 2012 Jan;80(1):194-202.</u></p> <p>[4]. <u>Brouwers J, Vermeire K, Grammen C, Schols D, Augustijns P. Early identification of availability issues for poorly water-soluble microbicide candidates in biorelevant media: a case study with saquinavir. Antiviral Res. 2011 Aug;91(2):217-23.</u></p> <p>[5]. <u>Knechten H, Lutz T, Pulik P, Martin T, Tappe A, Jaeger H. Safety and Efficacy in HIV-1-Infected Patients Treated with Ritonavir-Boosted Saquinavir Mesylate.</u></p>



源叶生物