

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	R10206
产品名称:	利托那韦

产品简介:

一种用于研究 HIV 感染和 AIDS 的 HIV 蛋白酶的抑制剂。Ritonavir is an inhibitor of HIV-1 protease used to treat HIV infection and AIDS. It is widely used a booster of other protease inhibitors. More specifically, ritonavir is used to inhibit a particular liver enzyme that normally metabolizes protease inhibitors, CYP3A4.

体外研究:

Ritonavir (ABT 538) 是 CYP3A4 介导的睾酮 6 β -羟基化抑制剂, 平均 K_i 为 19 nM, 也抑制甲苯磺丁脲羟基化, IC_{50} 为 4.2 μ M。

Ritonavir (ABT 538) 被发现是 CYP3A 介导的生物转化的有效抑制剂 (nifedipine oxidation with IC_{50} of 0.07 mM, 17 α -ethynylestradiol 2-hydroxylation with IC_{50} 2 mM; terfenadine hydroxylation, IC_{50} 为 0.14 mM)。Ritonavir 还是 CYP2D6 (IC_{50} =2.5 mM) 和 CYP2C9/10 (IC_{50} =8.0 mM) 介导的反应的抑制剂。

Ritonavir 导致未感染的人 PBMC 培养物中的细胞活力增加。Ritonavir 显著降低 PBMC 对细胞凋亡的易感性, 与较低水平的 caspase-1 表达相关, 减少膜联蛋白 V 染色, 并降低未感染的人 PBMC 培养物中的 caspase-3 活性。

Ritonavir 在无毒浓度下以时间和剂量依赖性方式抑制 PBMC 和单核细胞诱导肿瘤坏死因子 (TNF) 的产生。

Ritonavir 抑制 p-糖蛋白介导的沙奎那韦挤压作用, IC_{50} 为 0.2 μ M, 表明 Ritonavir 对 p-糖蛋白具有高亲和力。Ritonavir 有效抑制 ABT-378 的人肝微粒体代谢, K_i 为 13 nM。Ritonavir 与 ABT-378 联合使用 (比例为 3:1 和 29:1) 抑制 CYP3A (IC_{50} =1.1 和 4.6 μ M), 尽管不如 Ritonavir (IC_{50} =0.14 μ M)。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

DMSO: 溶于 DMSO (25 mg/mL 超声)

浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	1.3871 mL	6.9354 mL	13.8708 mL
5 mM	0.2774 mL	1.3871 mL	2.7742 mL
10 mM	0.1387 mL	0.6935 mL	1.3871 mL

储备液的保存方式: -80 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year。

二: 体内实验

1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE- β -CD in Saline)

Solubility: 2.5 mg/mL (3.47 mM); 悬浊液; 超声助溶

此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水水溶液中, 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。



2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: 2.5 mg/mL (3.47 mM); 澄清溶液; 加热助溶

此方案可获得 2.5 mg/mL 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

3、请依序添加每种溶剂： 17% Solutol HS-15 in Saline

Solubility: 10 mg/mL (13.87 mM); 悬浊液; 超声助溶

4、请依序添加每种溶剂： 0.5% CMC-Na/1% Tween-80 in Saline water

Solubility: 10 mg/mL (13.87 mM); 悬浊液; 超声助溶

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。

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。

注意事项：

1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存： -20℃

