

产品名称：利匹韦林  
产品别名：Rilpivirine

生物活性：				
Description	Rilpivirine (R278474; TMC278) is a type of anti-HIV medicine called a non-nucleoside reverse transcriptase inhibitor (NNRTI).			
IC <sub>50</sub> & Target	NNRTIs			
In Vitro	Rilpivirine(TMC278) is a next-generation nonnucleoside reverse transcriptase inhibitor (NNRTI), active against wild-type and NNRTI-resistant HIV-1. NNRTIs work by binding to and blocking HIV reverse transcriptase, an HIV enzyme. This prevents HIV from replicating and lowers the amount of HIV in the blood.			
Solvent&Solubility	<b><i>In Vitro:</i></b> <b>DMSO : 50 mg/mL (136.46 mM; Need ultrasonic)</b> <b>H<sub>2</sub>O : &lt; 0.1 mg/mL (insoluble)</b>			
	<div>Preparing Stock Solutions</div>	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg
		1 mM	2.7291 mL	13.6455 mL
		5 mM	0.5458 mL	2.7291 mL
		10 mM	0.2729 mL	1.3646 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。 <b><i>In Vivo:</i></b> 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 <b>In Vitro</b> 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: ≥ 3 mg/mL (8.19 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 3 mg/mL (8.19 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 30.0 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: 3 mg/mL (8.19 mM); Suspended solution; Need ultrasonic 此方案可获得 3 mg/mL (8.19 mM)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 μL 30.0 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: ≥ 3 mg/mL (8.19 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 3 mg/mL (8.19 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			

	<p>验。</p> <p>以 1 mL 工作液为例，取 100 <math>\mu</math>L 30.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 玉米油中，混合均匀。</p>
References	<p>[1]. <a href="#">Singh K, Marchand B, Rai DK, Sharma B, Michailidis E, Ryan EM, Matzek KB, Leslie MD, Hagedorn AN, Li Z, Norden PR, Hachiya A, Parniak MA, Xu HT, Wainberg MA, Sarafianos SG. Biochemical Mechanism of HIV-1 Resistance to Rilpivirine. J Biol Chem. 2012 Sep 6.</a></p> <p>[2]. <a href="#">Schafer JJ, Short WR. Rilpivirine, a novel non-nucleoside reverse transcriptase inhibitor for the management of HIV-1 infection: a systematic review. Antivir Ther. 2012 Jul 25.</a></p> <p>[3]. <a href="#">Vingerhoets J, Rimsky L, Van Eygen V, Nijs S, Vanveggel S, Boven K, Picchio G. Preexisting mutations in the rilpivirine Phase III trials ECHO and THRIVE: prevalence and impact on virologic response. Antivir Ther. 2012 Sep 6.</a></p> <p>[4]. <a href="#">Gomes T, Juurlink DN, Mamdani MM. Comparative adherence to oxybutynin or tolterodine among older patients. Eur J Clin Pharmacol. 2012 Jan;68(1):97-9. Epub 2011 Jun 28.</a></p> <p>[5]. <a href="#">Azijn, Hilde et al. TMC278, a next-generation nonnucleoside reverse transcriptase inhibitor (NNRTI), active against wild-type and NNRTI-resistant HIV-1. Antimicrobial Agents and Chemotherapy (2010), 54(2), 718-727.</a></p>

源叶生物