产品名称：**Lopinavir**
产品别名：洛匹那韦

生物活性：

Description

Lopinavir is a potent HIV protease inhibitor with Ki of 1.3 pM. Target: HIV protease Lopinavir is a potent inhibitor of Rh123 efflux in Caco-2 monolayers with IC50 of 1.7 mM. Lopinavir exposure (72 hours) in LS 180V cells reduces the content of intracellular Rh123. Lopinavir induces P-glycoprotein immunoreactive protein and messenger RNA levels in LS 180V cells. Lopinavir inhibits subtype C clone C6 with IC50 of 9.4 nM. Lopinavir inhibits CYP3A with IC50 of 7.3 mM in human liver microsomes, while produces negligible or weak inhibition of human CYP1A2, 2B6, 2C9, 2C19 and 2D6. Lopinavir (10 mg/kg, orally) results in Cmax of 0.8 μg/mL and oral bioavailability of 25% in rats.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : 100 mg/mL (159.03 mM; Need ultrasonic)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.5903 mL	7.9517 mL	15.9033 mL
	5 mM	0.3181 mL	1.5903 mL	3.1807 mL
	10 mM	0.1590 mL	0.7952 mL	1.5903 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。-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。

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: ≥ 2.5 mg/mL (3.98 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (3.98 mM，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；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% corn oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.98 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (3.98 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。

[1]. Vishnuvardhan, D., et al., Lopinavir: acute exposure inhibits P-glycoprotein; extended exposure induces P-glycoprotein. AIDS, 2003. 17(7): p. 1092-4.

[2]. Gonzalez, L.M., et al., In vitro hypersusceptibility of human immunodeficiency virus type 1 subtype C protease to lopinavir. Antimicrob Agents Chemother, 2003. 47(9): p. 2817-22.

References	[3]. Weemhoff, J.L., et al., Apparent mechanism-based inhibition of human CYP3A in-vitro by lopinavir. J Pharm Pharmacol, 2003. 55(3): p. 381-6. [4]. Sham, H.L., et al., ABT-378, a highly potent inhibitor of the human immunodeficiency virus protease. Antimicrob Agents Chemother, 1998. 42(12): p. 3218-24.