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：shyysw@sina.com

产品名称：R-7128
产品别名：Mericitabine；RG 7128; PSI 6130 diisobutyrate

生物活性：

Description	Mericitabine (RG 7128; R-7128) is a nucleoside inhibitor of the HCV NS5B polymerase that acts as an RNA chain terminator and prevents elongation of RNA transcripts during replication.
IC_{50} & Target	HCV NS5B polymerase[1]
In Vitro	Mericitabine (RG 7128; R-7128) is an oral prodrug of PSI-6130, a cytidine analogue. Pre-clinical observations demonstrated that PSI-6130 has an EC90 value of 4.6±2 μM in the HCV replicon assay. Mericitabine (RG 7128; R-7128) shows high specificity for HCV, minimal cytotoxicity and does not affect mitochondrial DNA. PSI-6130 is converted through phosphorylation by cellular kinases to an active 5′-triphosphate metabolite, which inhibits the NS5B RNA polymerase of HCV. Mericitabine (RG 7128; R-7128) demonstrates a relatively good safety profile and significant potency against HCV-1[2]. Mericitabine is a first-in class nucleoside polymerase inhibitor (NPI), which requires intracellular uptake and phosphorylation to two active triphosphates.Mericitabine (RG 7128; R-7128) is an oral cytidine nucleoside analog prodrug that exhibits strong antiviral effectiveness against the HCV polymerase across all HCV genotypes[3].
Solvent&Solubility	***In Vitro:*** **DMSO : 100 mg/mL** (**250.37 mM;** Need ultrasonic)

Preparing Stock Solutions

Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5037 mL	12.5185 mL	25.0369 mL
5 mM	0.5007 mL	2.5037 mL	5.0074 mL
10 mM	0.2504 mL	1.2518 mL	2.5037 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 (6.26 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.26 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% (20% SBE-β-CD in saline)

	Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.26 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.26 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 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.26 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.26 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。
References	[1]. Le Pogam S, et al. Characterization of HCV quasispecies dynamics upon short term dual-therapy with the HCV NS5B nucleoside polymerase inhibitor mericitabine and the NS3/4 protease inhibitor danoprevir. Antimicrob Agents Chemother. 2012 Nov;56(11):5494-5 [2]. Soriano V, et al. Directly acting antivirals against hepatitis C virus. J Antimicrob Chemother. 2011 Aug;66(8):1673-86 [3]. Guedj J, et al. Hepatitis C viral kinetics with the nucleoside polymerase inhibitor mericitabine (RG7128). Hepatology. 2012 Apr;55(4):1030-7.