



## Chirality Influence Towards Rivaroxaban-Zidovudine Interaction

Wen-Li WANG #, Yan-Mei LI #, Zhi-Lei XIE, & Dun-Yuan XU \*

*Yantaishan Hospital, Yantai, Shandong, China*

**SUMMARY.** Rivaroxaban is an oral, direct Factor Xa inhibitor, which has been clinically used for prevention and treatment of thromboembolic disorders. Rivaroxaban-zidovudine (AZT) interaction was determined in the present study. *In vitro* human liver microsomes (HLMs) incubation mixture was employed to form AZT glucuronide. (R)-rivaroxaban inhibited approximately 9% activity of AZT glucuronidation ( $p < 0.05$ ). Compared with (R)-rivaroxaban, (S)-rivaroxaban exhibited stronger inhibition capability than (R)-rivaroxaban ( $p < 0.001$ ). Furthermore, the concentration-dependent inhibition of (S)-rivaroxaban was demonstrated. The present study demonstrated the enantioselective inhibition of rivaroxaban towards the glucuronidation metabolism of AZT, indicating chirality influence towards rivaroxaban-zidovudine interaction.

**RESUMEN.** Rivaroxaban es un inhibidor oral directo del Factor Xa y se ha utilizado clínicamente para la prevención y tratamiento de trastornos tromboembólicos. En el presente estudio se determinó la interacción rivaroxaban-zidovudina (AZT). Se empleó como mezcla de incubación microsomas hepáticos humanos (HLM) *in vitro* para formar AZT glucurónido. (R)-rivaroxaban inhibió la actividad de aproximadamente el 9% de AZT glucuronidación ( $p < 0,05$ ). En comparación con (R)-rivaroxaban, (S)-rivaroxaban exhibió más fuerte capacidad de inhibición ( $p < 0,001$ ). Además se demostró la inhibición dependiente de la concentración de (S)-rivaroxaban. El presente estudio demostró la inhibición enantioselectiva de rivaroxaban hacia el metabolismo de la glucuronidación de AZT, indicando la influencia de la quiralidad sobre la interacción rivaroxaban-zidovudina.

**KEY WORDS:** chirality, rivaroxaban, thrombus, varix of lower limb, zidovudine.

\* Author to whom correspondence should be addressed: *E-mail:* xudunyuantai@163.com

# These two authors equally contributed to this work.