

Pritelivir (普瑞利韦)

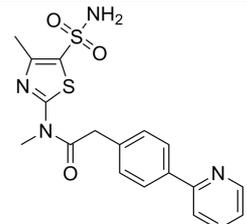
产品编号: MC8020

质量标准: >99%, BR

包装规格: 5mg / 10mg / 50mg / 100mg

产品形式: 固体

基本信息:

分子式	C ₁₈ H ₁₈ N ₄ O ₃ S ₂	结构式	
分子量	402.49		
CAS No.	348086-71-5		
储存条件	2~8℃, 避光防潮密闭干燥		
运输条件	常温运输		

简介: Pritelivir 是一种病毒解旋酶-引物酶复合物抑制剂, 在体外和单纯疱疹病毒 (HSV)感染的动物模型中均具有抗病毒活性。Pritelivir 对 1 型和 2 型单纯疱疹病毒(HSV-1 和 HSV-2)具有活性, 对 HSV1-2 的 IC₅₀ 为 0.02μM。

别名: AIC316; BAY 57-1293

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: ≥33mg/mL; 水、乙醇中不溶

有机溶剂残留:符合 ICH 及中国药典规定

纯度:>99%

用途及描述: 科研试剂, 仅限应用于分子生物学、药理学等科研方面, 严禁用于人体。Pritelivir 是一种新型、高活性的单纯疱疹病毒 (HSV) 小分子抑制剂, 对 HSV-1 和 HSV-2 均具有活性, 并对市售药物产生抗药性的病毒也具有活性。Pritelivir 可用于治疗免疫功能低下、对阿昔洛韦 (核苷类似物) 耐药的黏膜皮肤 HSV 感染成人患者。Pritelivir 与核苷类似物阿昔洛韦相比具有不同的抗病毒作用机制, 核苷类似物通过抑制病毒 DNA 聚合酶来终止正在进行的 DNA 链延长, 而 Pritelivir 则通过抑制解旋酶-引物复合物来阻止病毒 DNA 的从头合成。此外, 它不需要在 HSV 感染的细胞内被病毒胸苷激酶激活, 因此对未感染的细胞也具有保护作用。

生物活性:

靶点	HSV-1: 0.02μM(IC ₅₀); HSV-2: 0.02μM(IC ₅₀)
体外研究	Pritelivir 剂量依赖的直接抑制病毒解旋酶-引发酶复合物的 ATPase 活性。Pritelivir 对耐阿昔洛韦的 HSV 突变体也有明显的抗病毒活性。在绿猴肾细胞中, 其还可降低 HSV-1 引起的 Aβ 和 P-tau ^[1] 。
体内研究	Pritelivir 是一类新型抗病毒药物中的首个, 它通过靶向病毒的解旋酶-引物酶复合体来抑制 HSV 复制 ^[2] ; Pritelivir (0.03-45mg/kg) 能显著提高生存率。Pritelivir (0.3-30mg/kg) 能降低 HSV-1 和 E-377 的致死率。Pritelivir 具有强大且能克服耐药性的抗病毒效果, 有潜力治疗可能危及生命的 HSV-1 和 HSV-2 感染, 包括单纯疱疹病毒性脑炎 ^[3] ; Pritelivir 与阿昔洛韦 (Acyclovir) 联合疗法, Pritelivir 剂量为 0.1 或 0.3mg/kg/剂量, 阿昔洛韦剂量为 10mg/kg/剂量, 与对照组相比, 对 HSV-2 的 MS 株具有保护作用 ^[3] 。

溶液配制:



制备储备液	溶剂体积 / 质量		1mg	5mg	10mg
	浓度				
	1mM		2.4845 mL	12.4227 mL	24.8453 mL
	5mM		0.4969 mL	2.4845 mL	4.9691 mL
	10mM		0.2485 mL	1.2423 mL	2.4845 mL

使用方法：（仅供参考）

激酶试验	体外 procaspase-3 激活: procaspase-3 在大肠杆菌中表达并纯化。在 96 孔板中, 将不同浓度的 PAC-1 添加到 90 μ L 的 50ng/mL procaspase-3 的 caspase 测定缓冲液中, 孔板在 37 $^{\circ}$ C 下孵育 12 小时。然后, 向每个孔中添加 10 μ L 的 2mM 的 caspase-3 肽类底物乙酰天冬氨酸-谷氨酸-缬氨酸-天冬氨酸对硝基苯胺(Ac-DEVD-pNa)的 caspase 测定缓冲液溶液。使用 Spectra Max Plus 384 孔板读取器, 每 2 分钟在 405nm 处读取一次, 持续 2 小时。确定每个孔线性部分的斜率, 并计算与未处理对照孔的激活相对增加量。
动物实验	Animal Models: 雌性 BALB/c 小鼠 Formulation: 混悬于 1% CMC Dosages: 0.03~45 mg/kg , 每日 2 次, 间隔约 12 小时, 用药 7 日 Administration: 口服灌胃

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理 (如 0.22 μ m 滤膜过滤), 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。
- 科研试剂, 广泛应用于分子生物学、药理学等科研方面, 严禁用于人体。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

参考文献

- [1]. M A Wozniak, et al. The helicase-primase inhibitor BAY 57-1293 reduces the Alzheimer's disease-related molecules induced by herpes simplex virus type 1. Antiviral Res. 2013 Sep;99(3):401-4.
- [2]. Wald A, et al. Helicase-primase inhibitor Pritelivir for HSV-2 infection. N Engl J Med. 2014 Jan 16;370(3):201-10.
- [3]. Quenelle DC, et al. Efficacy of pritelivir and acyclovir in the treatment of herpes simplex virus infections in a mouse model of herpes simplex encephalitis. Antiviral Res. 2018 Jan;149:1-6.

S241001

