

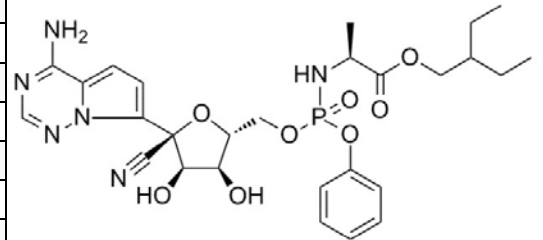
## Remdesivir (广谱抗病毒剂)

产品编号	产品名称	包装
SF1193-10mM	Remdesivir (广谱抗病毒剂)	10mM
SF1193-5mg	Remdesivir (广谱抗病毒剂)	5mg
SF1193-25mg	Remdesivir (广谱抗病毒剂)	25mg
SF1193-100mg	Remdesivir (广谱抗病毒剂)	100mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-ethylbutyl(2S)-2-[[[(2R,3S,4R,5R)-5-(4-aminopyrrolo[2,1-f][1,2,4]triazin-7-yl)-5-cyano-3,4-dihydroxyoxolan-2-yl]methoxy-phenoxyphosphoryl]amino]propanoate
简称	GS-5734
别名	Remdesivir
中文名	瑞德西韦
化学式	C <sub>27</sub> H <sub>35</sub> N <sub>6</sub> O <sub>8</sub> P
分子量	602.58
CAS号	1809249-37-3
纯度	>99.5%
溶剂/溶解度	DMSO ≥ 125 mg/ml
溶液配制	5mg 加入 0.830ml DMSO, 或者每 6.02mg 加入 1ml DMSO, 配制成10mM溶液。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Remdesivir是腺苷类似物的单磷酸酰胺酸盐前药、RNA依赖的RNA聚合酶(RdRp)抑制剂、一种广谱抗病毒剂。在体内和体外实验中对多种病毒如鼠肝炎病毒(Murine hepatitis virus)、Ebola病毒、MERS-CoV病毒和SARS-CoV病毒等具有抑制作用。研究证实, Remdesivir对新型冠状病毒肺炎病毒COVID-19同样具有抑制作用。				
信号通路	Anti-infection; Cell Cycle/DNA Damage; DNA/RNA Synthesis				
靶点	SARS-CoV (HAE cells)	MERS-CoV (HAE cells)	Murine hepatitis virus (delayed brain tumor cells)	Ebola virus (HeLa, HFF-1, HMVEC-TERT, Huh-7 cells)	COVID-19 (Vero E6 cells)
EC50	69nM	74nM	30nM	60-140nM	0.77μM
体外研究	Remdesivir抗病毒的机制是抑制病毒RdRp。在HAE细胞中, 对SARS-CoV和MERS-CoV的EC50值分别为69nM和74nM; 在延迟脑肿瘤细胞中, 对鼠肝炎病毒的EC50值为30nM。Remdesivir对Ebola病毒的EC50在HeLa细胞中为140nM; HFF-1细胞中为130nM; HMVEC-TERT细胞中为60nM; Huh-7细胞中为70nM。在Vero E6细胞中, Remdesivir对COVID-19病毒的EC50为0.77μM。				
体内研究	Remdesivir在恒河猴模型中显示出抗MERS-CoV、SARS-CoV等病毒的作用, 显著缓解了病毒感染的实验动物的呼吸道疾病症状, 具体表现为病毒的复制水平明显降低, 肺损伤得到改善。在新冠病毒COVID-19感染的恒河猴模型中, 静脉注射Remdesivir给药后, 与对照组相比, 给药组恒河猴的肺部炎症减轻、病毒数量减少、呼吸困难和肺损伤得到改善。				
临床实验	2020年4月10日发表于New England Journal of Medicine的Remdesivir临床试验报道了53例被确诊为COVID-19病毒感染并住院的患者使用Remdesivir治疗的情况。有限的临床数据显示, 68%的重症新冠肺炎患者临床症状由于Remdesivir的治疗而得到了改善。				
特征	在体内和体外试验中均显示良好的广谱抗病毒作用。				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	MERS-CoV或SARS-CoV感染的HAE细胞
浓度	<1 $\mu$ M
处理时间	24h
方法	用含或不含Remdesivir的培养基分别处理病毒感染后的细胞和未经病毒感染的细胞。24h后分别测定细胞和病毒的平均活性，然后用软件计算Remdesivir的EC50。

动物实验	
动物模型	Ebola病毒感染的恒河猴模型
配制	12% sulfobutylether- $\beta$ -cyclodextrin, pH3.0
剂量	3, 10mg/kg
给药方式	i.v.

### 参考文献：

1. Wang M, et al. Remdesivir and chloroquine effectively inhibit the recently emerged novel coronavirus (2019-nCoV) in vitro. Cell Res. 2020 Mar;30(3):269271.
2. Warren T K, et al. Therapeutic efficacy of the small molecule GS-5734 against Ebola virus in rhesus monkeys. Nature, 2016, 531(7594):381-385.
3. Agostini M L, et al. Coronavirus Susceptibility to the Antiviral Remdesivir (GS-5734) Is Mediated by the Viral Polymerase and the Proofreading Exoribonuclease. Mbio, 2018, 9(2):e00221-18.
4. Brandi W, et al. Clinical benefit of remdesivir in rhesus macaques infected with SARS-CoV-2. bioRxiv(2020).
5. Jonathan G, et al. Compassionate Use of Remdesivir for Patients with Severe Covid-19. NEJM (2020).
6. Le Bras, A. Efficacy of remdesivir in a rhesus macaque model of MERS-CoV infection. Lab Anim 49, 150 (2020).

### 包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SF1193-10mM	Remdesivir (广谱抗病毒剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SF1193-5mg	Remdesivir (广谱抗病毒剂)	5mg
SF1193-25mg	Remdesivir (广谱抗病毒剂)	25mg
SF1193-100mg	Remdesivir (广谱抗病毒剂)	100mg
—	说明书	1份

### 保存条件：

-20 $^{\circ}$ C保存，至少一年有效。5mg、25mg和100mg包装也可室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存，预计6个月内有效。

### 注意事项：

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

### 使用说明：

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000 $\times$ g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降于管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2020.04.23