



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: shyyssw@sina.com

产品名称: **Bemnifosbuvir hemisulfate (Synonyms: AT-527)**

CAS 号: **2241337-84-6**

产品货号: **S89296**

生物活性:				
Description	Bemnifosbuvir hemisulfate (AT-527), AT-511 的半硫酸盐, 是鸟苷核苷酸前体, 是一种有效的具有口服活性的 HCV 病毒复制抑制剂。Bemnifosbuvir hemisulfate 有效抑制 SARS-CoV-2 (COVID-19) 感染 (EC90=0.47 μ M)。Bemnifosbuvir hemisulfate 具有全基因型抗病毒活性。			
IC50 & Target	EC50: 5-28 nM (HCV)[1] EC90: 0.47 μ M (SARS-CoV-2)[2]			
In Vitro	Bemnifosbuvir hemisulfate 具有泛基因型抗病毒活性, 抑制 HCV 基因型 1a (HCV GT1a)、HCV GT1b、HCV GT2a、HCV GT3a、HCV GT4a 和 HCV GT5a 的复制, EC50 值分别为 12.8 nM、12.5 nM、9.2 nM、10.3 nM、14.7 nM 和 28.5 nM[1]。 在正常人气道上皮细胞中, Bemnifosbuvir hemisulfate 抑制 SARS-CoV-2 复制的 IC90 值为 0.47 μ M, 与其在 Huh-7 细胞中抑制 HCoV-229E、HCoV-OC43 和 SARS-CoV 的 EC90 非常相似[2]。			
In Vivo	当口服给予大鼠 (500 mg/kg) 和猴子 (30 mg/kg、100 mg/kg 或 300 mg/kg) 时, Bemnifosbuvir (hemisulfate) 优先在体内肝脏中递送高水平的 AT-9010[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 180 mg/mL (285.45 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) H2O 中的溶解度 : $\geq$ 100 mg/mL (158.58 mM) * " $\geq$ " means soluble, but saturation unknown			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
				10 mg
		1 mM	1.5858 mL	7.9292 mL
		5 mM	0.3172 mL	1.5858 mL
		10 mM	0.1586 mL	0.7929 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 (sealed storage, away from moisture)。-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。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。 动物实验: 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 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: $\geq$ 5 mg/mL (7.93 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 50.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1				



	mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 5 mg/mL (7.93 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 5 mg/mL (7.93 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Steven S Good, et al. Preclinical evaluation of AT-527, a novel guanosine nucleotide prodrug with potent, pan-genotypic activity against hepatitis C virus. PLoS One. 2020 Jan 8;15(1):e0227104. [2]. Steven S Good, et al. AT-527, a double prodrug of a guanosine nucleotide analog, is a potent inhibitor of SARS-CoV-2 in vitro and a promising oral antiviral for treatment of COVID-19. Antimicrob Agents Chemother. 2021 Feb 8;AAC.02479-20. [3]. Elina Berliba, et al. Safety, pharmacokinetics and antiviral activity of AT-527, a novel purine nucleotide prodrug, in HCV-infected subjects with and without cirrhosis. Antimicrob Agents Chemother. 2019 Sep 30;63(12):e01201-19.

完整储备液配制表:

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 (sealed storage, away from moisture)。-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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
H ₂ O/DMSO	1 mM	1.5858 mL	7.9292 mL	15.8584 mL	39.6460 mL
	5 mM	0.3172 mL	1.5858 mL	3.1717 mL	7.9292 mL
	10 mM	0.1586 mL	0.7929 mL	1.5858 mL	3.9646 mL
	15 mM	0.1057 mL	0.5286 mL	1.0572 mL	2.6431 mL
	20 mM	0.0793 mL	0.3965 mL	0.7929 mL	1.9823 mL
	25 mM	0.0634 mL	0.3172 mL	0.6343 mL	1.5858 mL
	30 mM	0.0529 mL	0.2643 mL	0.5286 mL	1.3215 mL



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

	40 mM	0.0396 mL	0.1982 mL	0.3965 mL	0.9912 mL
	50 mM	0.0317 mL	0.1586 mL	0.3172 mL	0.7929 mL
	60 mM	0.0264 mL	0.1322 mL	0.2643 mL	0.6608 mL
	80 mM	0.0198 mL	0.0991 mL	0.1982 mL	0.4956 mL
	100 mM	0.0159 mL	0.0793 mL	0.1586 mL	0.3965 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶