

NEW

インフルエンザウイルスのキャップ依存性エンドヌクレアーゼ阻害物質 Baloxavir Acid / Baloxavir Marboxil

Baloxavir Acid およびそのプロドラッグ Baloxavir Marboxil は、インフルエンザウイルスの増殖に関わるキャップ依存性エンドヌクレアーゼに対して、強い阻害活性を示すことから、インフルエンザウイルスの新規増殖阻害物質として注目されています。

※本製品は研究用です。研究用以外には使用できません。

MEMO

Baloxavir Acid / Marboxil の作用メカニズム

インフルエンザウイルスは宿主細胞に感染後、宿主細胞の核内でキャップ依存性エンドヌクレアーゼを用いて、ウイルス mRNA 合成を促します。キャップ依存性エンドヌクレアーゼは、キャップ構造を有する宿主の mRNA 前駆体を特異的に切断する酵素で、ウイルスの mRNA 合成に必要な RNA 断片を生成します。Baloxavir Acid はキャップ依存性エンドヌクレアーゼ活性を阻害することで、インフルエンザウイルスの増殖を抑制します。Baloxavir Marboxil は Baloxavir Acid のプロドラッグで、小腸、血液、肝臓中のエステラーゼによって分解され活性本体 Baloxavir Acid に変換されます。in vitro 酵素阻害実験や培養細胞の実験には Baloxavir Acid, in vivo マウス実験には Baloxavir Marboxil を推奨しています。

使用例

■Baloxavir Acid : A 型及び B 型インフルエンザウイルス実験室株に対する各薬剤のウイルス増殖抑制効果*1

型/亜型	株	EC ₅₀ (nmol/L)				
		Baloxavir acid	Oseltamivir acid	Zanamivir hydrate	Laninamivir	Favipiravir
A/H1N1	A/WSN/33	0.79±0.13	160±190	230±160	18±8.6	3,800±1,000
A/H1N1	A/WSN/33-NA/H274Y	0.46±0.14	>400	200±33	19±9.5	3,100±860
A/H1N1	A/PR/8/34	0.79±0.12	180±74	170±54	9.0±7.9	3,900±1,800
A/H3N2	A/Victoria/3/75	0.98±0.20	65±45	200±160	45±36	4,800±1,000
A/H3N2	A/Hong Kong/8/68	0.64±0.30	44±26	98±73	23±19	2,900±1,100
B	B/Maryland/1/59	3.1±1.2	250±170	60±27	21±4.1	2,700±550
B	B/Hong Kong/5/72	2.2±0.65	540±210	180±67	41±15	1,800±1,000
B	B/Lee/40	3.4±1.3	370±150	250±210	46±14	3,700±480

5 株の A 型及び 3 株の B 型インフルエンザウイルス実験室株を MDCK 細胞に感染させ、種々の濃度の化合物存在化で培養し、翌日の培養上清中に放出されたウイルス力価を測定した。

*1 Noshi, et al., *Antiviral Res.*, **160**, 109~117 (2018). より抜粋

*2 Fukao, et al., *PLoS One*, **14**, e0217307 (2019). より抜粋

特長

- Baloxavir Acid は、in vitro エンドヌクレアーゼ活性測定系やインフルエンザ感染細胞におけるウイルス増殖抑制試験に利用できます。
- Baloxavir Marboxil は、in vivo マウス実験に使用できます。

阻害活性が確認されたインフルエンザ実験室株

- A/H1N1 型 (A/WSN/33, A/WSN/33-NA/H274Y, A/PR/8/34)
- A/H3N2 型 (A/Victoria/3/75, A/Hong Kong/8/68)
- A/H7N9 型 (A/Anhui/1/2013)
- B 型 (B/Maryland/1/59, B/Hong Kong/5/72, B/Lee/40)

■Baloxavir Marboxil : A 型インフルエンザウイルス感染モデルにおける生存率*2

ウイルス接種量: 4.6 log₁₀ TCID₅₀/マウス



log-rank検定

***: p<0.001(vs 溶媒対照群) ***: p<0.0001(vs 溶媒対照群)

†: p<0.0005(vs オセルタミビルリン酸塩5mg/kg BID5日投与群)

A 型 H1N1 亜型インフルエンザウイルス 4.6 log₁₀TCID₅₀ を経鼻接種したマウスモデルにおいて、Baloxavir Marboxil 0.05~5 mg/kg (単日2回) 投与群または Oseltamivir Phosphate (1日1回で5日間) 投与群の接種後21日間の生存を観察した。

化合物情報

[メーカー: SNG]

品名	Baloxavir Acid	Baloxavir Marboxil
構造式		
分子量	483.49	571.55
CAS No.	1985605-59-1	1985606-14-1
商品コード	SH-02 NEW	SH-01 NEW
包装/価格 (¥)	2 mg / 41,700	10 mg / 100,000

※本製品は受注生産品です。納期はお問い合わせ下さい。

ご購入時のご注意

本製品は塩野義製薬株式会社が特許権を保持し、販売する承認医薬品の有効成分です。当社では試験研究以外の目的で購入・使用されることを防止するため、ご使用者様・ご使用目的を確認の上、販売させていただいております。

製品のご購入には専用注文書への記入が必要です。非営利機関(アカデミア)に所属するお客様と営利企業に所属するお客様でご記入いただくフォーマットが異なりますのでご注意ください。なお、本専門注文書はご購入のたびにご提出いただく必要があります。製品の使用目的的確約書兼専用注文書は、Web ページ番号: 68975 からダウンロードできます。