

Нелфинавир ингибирует репликацию тяжелого острого респираторного синдрома коронавируса

<https://www.biorxiv.org/content/10.1101/2020.04.06.026476v1>

Norio Yamamoto^{1,2,3}, Shutoku Matsuyama⁴, Tyuji Hoshino⁵, and Naoki Yamamoto⁶
08.04.20

1. Department of Virology, Division of Host Defense Mechanism, Tokai University School of Medicine, 143 Shimokasuya, Isehara, Kanagawa 259-1193, Japan
2. Department of Microbiology, Juntendo University School of Medicine, 2-1-1 Hongo, Bunkyo-ku, Tokyo 113-8421, Japan
3. Influenza Virus Research Center, National Institute of Infectious Diseases, 4-7-1 Gakuen, Musashi-murayama, Tokyo 208-0011, Japan
4. Department of Virology III, National Institute of Infectious Diseases, 4-7-1 Gakuen, Musashi-murayama, Tokyo 208-0011, Japan
5. Graduate School of Pharmaceutical Sciences, Chiba University, 1-8-1 Inohana, Chuo-ku, Chiba 260-8675, Japan
6. Department of Molecular Virology, Graduate School of Medicine, Tokyo Medical and Dental University, 1-5-45, Yushima, Bunkyo-ku, Tokyo 113-8519, Japan

В декабре 2019 года в Ухане, провинция Хубэй, Китай, возник коронавирус с тяжелым острым респираторным синдромом 2 (SARS-CoV-2). До сих пор не было найдено никакого специфического лечения против коронавирусной болезни-2019 (COVID-19) с доказанной эффективностью. Поэтому срочно необходимо определить эффективные противовирусные средства для лечения этого заболевания, и были оценены несколько одобренных препаратов, из группы ингибиторов протеазы ВИЧ, таких как лопинавир.

Установлено, что нелфинавир, ингибитор протеазы ВИЧ-1, в культуре клеток потенциально ингибирует репликацию SARS-CoV-2. Эффективные концентрации для 50% и 90% ингибирования (EC50 и EC90) нелфинавира составляли 1,13 мкМ и 1,76 мкМ соответственно, и были самыми низкими в группе из девяти ингибиторов протеазы ВИЧ-1, включая лопинавир. Плато и пиковые концентрации нелфинавира в сыворотке крови были в три-шесть раз выше, чем ЭК50 этого препарата. Эти результаты позволяют предположить, что нелфинавир является потенциальным препаратом-кандидатом для лечения КОВИД-19 и должен оцениваться у пациентов с КОВИД-19.