产品名称：西维来司他
产品别名：**Sivelestat**

生物活性：

Description

Sivelestat(ONO5046; LY544349; EI546) is a competitive inhibitor of human neutrophil elastase(IC50 = 44 nM; Ki=200 nM); also inhibited leukocyte elastase obtained from rabbit, rat, hamster and mouse. IC50 value: 44 nM [1] Target: neutrophil elastase ONO-5046 did not inhibit trypsin, thrombin, plasmin, plasma kallikrein, pancreas kallikrein, chymotrypsin and cathepsin G even at 100 microM. In in vivo studies, ONO-5046 suppressed lung hemorrhage in hamster (ID50 = 82 micrograms/kg) by intratracheal administration and increase of skin capillary permeability in guinea pig (ID50 = 9.6 mg/kg) by intravenous administration, both of which were induced by human neutrophil elastase [1]. Sivelestat sodium hydrate is an anti-neutrophil elastase inhibitor and may be one of the treatment options for acute respiratory failure due to pneumocystis pneumonia in AIDS patients [2].

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : ≥ 100 mg/mL (230.17 mM)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.3017 mL	11.5085 mL	23.0171 mL
	5 mM	0.4603 mL	2.3017 mL	4.6034 mL
	10 mM	0.2302 mL	1.1509 mL	2.3017 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。-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。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.75 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.75 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.75 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.75 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 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。

3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil

	Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.75 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.75 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
References	[1]. Kawabata K, et al. ONO-5046, a novel inhibitor of human neutrophil elastase. Biochem Biophys Res Commun. 1991 Jun 14;177(2):814-20. [2]. Imokawa S, et al. Acute respiratory failure due to pneumocystis pneumonia successfully treated with combined use of sivelestat sodium hydrate. Nihon Kokyuki Gakkai Zasshi. 2008 Jun;46(6):461-5.