



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: **CAY10594**
CAS 号: **1130067-34-3**
产品货号: **S87919**

生物活性:				
Description	CAY10594 是一种口服有效的 PLD2 抑制剂, IC50 为 140 nM。CAY10594 具有抗肿瘤、抗氧化和肝保护等活性。CAY10594 可用于乳腺癌、急性肝损伤和结肠炎等疾病的研究[1]。			
IC50 & Target[2][3][4]	p-STAT3	GSK-3β	IL-6	IL-17A IL-23 IL-1β CXCR2 GRK2
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	Calu-1	IC50	1000 nM	Inhibition of PLD1 in human Calu-1 cells assessed as decrease in phosphatidylbutanol-[d9] production after 30 mins by mass spectrometric analysis
	HEK293	IC50	110 nM	Inhibition of GFP-tagged human PLD2 expressed in human HEK293 cells assessed as decrease in phosphatidylbutanol-[d9] production after 30 mins by mass spectrometric analysis
In Vitro	CAY10594 (Compound 72) (20 μM; 48 h) 可抑制 MDA-231、4T1 和 PMT 乳腺癌细胞的迁移[1]。			
	CAY10594 (10 μM; 7 h) 在 HUVECs 中, 可改善 LPS (HY-D1056) 诱导的内皮细胞通透性增加和跨内皮电阻降低, 抑制磷脂酸生成、STAT3 磷酸化以改善紧密连接蛋白的表达[2]。			
	CAY10594 (10 μM; 0-16 h) 在原代肝细胞中显著减少 Acetaminophen (HY-66005) 诱导的乳酸脱氢酶释放和细胞死亡, 并阻断 GSK-3β 磷酸化[3]。			
	Western Blot Analysis[2]			
	Cell Line:	Human umbilical vein endothelial cells (HUVECs) treated LPS (HY-D1056)		
	Concentration:	10 μM		
	Incubation Time:	Pretreated with 1 h, then co-incubation for 6 h		
	Result:	Increased the levels of occludin and ZO-1.		
	Western Blot Analysis[3]			
	Cell Line:	Primary hepatocyte treated Acetaminophen (HY-66005)		
Concentration:	10 μM			
Incubation Time:	0, 2, 4, 6, 8 and 10 h			
Result:	Inhibited the level of pGSK-3 尾.			
In Vivo	CAY10594 (1-8 mg/kg; 腹腔注射; 单剂量) 在急性肝损伤小鼠模型中具有保护作用[3]。			
	CAY10594 (4 mg/kg; 灌胃; 10 天) 在结肠炎小鼠模型中具有改善作用[4]。			
	Animal Model:	C57BL/6 mice treated Acetaminophen (HY-66005) to induce acute liver injury[3]		
	Dosage:	1, 4 and 8 mg/kg		
	Administration:	Intraperitoneal injection; single dose		
	Result:	Significantly alleviated hepatic pathological damage, as demonstrated by reduced necrosis and apoptosis in liver tissue sections.		
	Decreased serum levels of AST and ALT, key markers of liver injury.			
	Improved the survival rate of mice.			



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

	Animal Model:	C57BL/6 mice (20-25 g, 8-10 weeks old) treated DSS (HY-116282C) to induce colitis[4]			
	Dosage:	4 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage; 10 days			
	Result:	Significantly improved clinical symptoms including higher survival rate, less body weight loss, and reduced bloody stools. Alleviated pathological damage in colon tissues, Decreased proinflammatory cytokines (TNF- α , IL-6, IL-17A, IL-23, IL-1 β) expression, increased anti-inflammatory cytokine (IL-10) expression, and promoted neutrophil migration by upregulating CXCR2 and downregulating GRK2.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (233.36 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent \ Mass \ Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.3336 mL	11.6678 mL	23.3356 mL
		5 mM	0.4667 mL	2.3336 mL	4.6671 mL
		10 mM	0.2334 mL	1.1668 mL	2.3336 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。 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 1.14 mg/mL (2.66 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.14 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 11.4 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 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% Corn Oil Solubility: ≥ 1.14 mg/mL (2.66 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.14 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				



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

	情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 11.4 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Scott SA, et al. Design of isoform-selective phospholipase D inhibitors that modulate cancer cell invasiveness. Nat Chem Biol. 2009 Feb;5(2):108-17. [2]. Qian T, et al. PLD2 deletion alleviates disruption of tight junctions in sepsis-induced ALI by regulating PA/STAT3 phosphorylation pathway. Int Immunopharmacol. 2023 Jan;114:109561. [3]. Lee SK, et al. A phospholipase D2 inhibitor, CAY10594, ameliorates acetaminophen-induced acute liver injury by regulating the phosphorylated-GSK-3 β /JNK axis. Sci Rep. 2019 May 10;9(1):7242. [4]. Zhou G, et al. Blockade of PLD2 Ameliorates Intestinal Mucosal Inflammation of Inflammatory Bowel Disease. Mediators Inflamm. 2016;2016:2543070.

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。 -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
DMSO	1 mM	2.3336 mL	11.6678 mL	23.3356 mL	58.3390 mL
	5 mM	0.4667 mL	2.3336 mL	4.6671 mL	11.6678 mL
	10 mM	0.2334 mL	1.1668 mL	2.3336 mL	5.8339 mL
	15 mM	0.1556 mL	0.7779 mL	1.5557 mL	3.8893 mL
	20 mM	0.1167 mL	0.5834 mL	1.1668 mL	2.9169 mL
	25 mM	0.0933 mL	0.4667 mL	0.9334 mL	2.3336 mL
	30 mM	0.0778 mL	0.3889 mL	0.7779 mL	1.9446 mL
	40 mM	0.0583 mL	0.2917 mL	0.5834 mL	1.4585 mL
	50 mM	0.0467 mL	0.2334 mL	0.4667 mL	1.1668 mL
	60 mM	0.0389 mL	0.1945 mL	0.3889 mL	0.9723 mL
	80 mM	0.0292 mL	0.1458 mL	0.2917 mL	0.7292 mL
	100 mM	0.0233 mL	0.1167 mL	0.2334 mL	0.5834 mL