



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: Etalocib
CAS 号: 161172-51-6
产品货号: S87925

生物活性:

Description	Etalocib (LY293111) 是具有口服活性的白三烯 (LTB4) 受体的拮抗剂，抑制 [3H]LTB4 结合的 Ki 值为 25 nM。Etalocib (LY293111) 抑制 LTB4 诱导的钙动员的 IC50 值为 20 nM。Etalocib (LY293111) 可诱导凋亡。		
IC50 & Target	LTB4.		
In Vitro	Etalocib 引发浓度依赖性抑制 LTB4 诱导的 CD11b 上调[1]。		
	Etalocib 是一种体外极其有效且选择性的人类中性粒细胞功能拮抗剂[2]。		
	Etalocib (250 和 500 nM, 24-72 小时) 诱导人胰腺癌细胞凋亡并抑制其增殖[3]。		
	Cell Proliferation Assay[3]		
	Cell Line:	MiaPaCa-2 and AsPC-1 human pancreatic cancer cells.[3]	
	Concentration:	500 nM.	
	Incubation Time:	24, 48, and 72 h.	
	Result:	Caused both a concentration-dependent and time-dependent inhibition of thymidine incorporation in both MiaPaCa-2 and AsPC-1 human pancreatic cancer cells.	
	Apoptosis Analysis[3]		
	Cell Line:	MiaPaCa-2 and AsPC-1 human pancreatic cancer cells.	
	Concentration:	250 and 500 nM.	
	Incubation Time:	24 h.	
Result:	Induced apoptosis in human pancreatic cancer cells.		
In Vivo	Etalocib 静脉注射 (ED50=14 µg/kg) 或口服 (ED50=0.4 mg/kg) 时，可产生剂量相关的急性白三烯 B4 诱发气道阻塞抑制[2]。		
	Etalocib (10 mg/kg) 可在 1 小时内抑制 A23187 诱发的肺部炎症变化[2]。		
	Etalocib (250 mg/kg/天，口服) 可抑制无胸腺小鼠中人胰腺癌异种移植瘤的生长[3]		
	Animal Model:	Guinea pigs[2].	
	Dosage:	1-10 mg/kg.	
	Administration:	Orally once.	
	Result:	A single 1 mg/kg oral dose inhibited excised lung gas volume increases by 76.7±7.1% (n=4, P<0.002) when given 8 h prior to leukotriene B4 challenge, and 28.6±20.3% (n=4, NS) when given 24 h before challenge.	
	Had no effect (10 mg/kg) on pulmonary gas trapping at 1 h or 2 h after A23187 challenge. However, at 4 h, the pulmonary gas trapping response was significantly less than that of vehicle-treated controls and not different from sham values. The 10 mg/kg dose inhibited A23187-induced lung inflammatory changes at 1 h, but was without effect at 2 h or 4 h after challenge.		
	Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (183.62 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)	



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

	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.8362 mL	9.1809 mL	18.3618 mL
		5 mM	0.3672 mL	1.8362 mL	3.6724 mL
		10 mM	0.1836 mL	0.9181 mL	1.8362 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时，请在 2 年内使用， -20°C 储存时，请在 1 年内使用。 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (4.59 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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。 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 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.59 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. P Marder, et al. Blockade of Human Neutrophil Activation by 2-[2-propyl-3-[3-[2-ethyl-4-(4-fluorophenyl)-5- Hydroxyphenoxy]propoxy]phenoxy]benzoic Acid (LY293111), a Novel Leukotriene B4 Receptor Antagonist. Biochem Pharmacol. 1995 May 26;49(11):1683-90. [2]. S A Silbaugh, et al. Pharmacologic Actions of the Second Generation Leukotriene B4 Receptor Antagonist LY29311: In Vivo Pulmonary Studies. Naunyn Schmiedebergs Arch Pharmacol. 2000 Apr;361(4):397-404. [3]. Wei-Gang Tong, et al. Leukotriene B4 Receptor Antagonist LY293111 Inhibits Proliferation and Induces Apoptosis in Human Pancreatic Cancer Cells. Clin Cancer Res. 2002 Oct;8(10):3232-42.				
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, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时，请在 2 年内使用， -20° C 储存时，请在 1 年内使用。					



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: shyyw@sina.com

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.8362 mL	9.1809 mL	18.3618 mL	45.9044 mL
	5 mM	0.3672 mL	1.8362 mL	3.6724 mL	9.1809 mL
	10 mM	0.1836 mL	0.9181 mL	1.8362 mL	4.5904 mL
	15 mM	0.1224 mL	0.6121 mL	1.2241 mL	3.0603 mL
	20 mM	0.0918 mL	0.4590 mL	0.9181 mL	2.2952 mL
	25 mM	0.0734 mL	0.3672 mL	0.7345 mL	1.8362 mL
	30 mM	0.0612 mL	0.3060 mL	0.6121 mL	1.5301 mL
	40 mM	0.0459 mL	0.2295 mL	0.4590 mL	1.1476 mL
	50 mM	0.0367 mL	0.1836 mL	0.3672 mL	0.9181 mL
	60 mM	0.0306 mL	0.1530 mL	0.3060 mL	0.7651 mL
	80 mM	0.0230 mL	0.1148 mL	0.2295 mL	0.5738 mL
	100 mM	0.0184 mL	0.0918 mL	0.1836 mL	0.4590 mL

源叶