



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: shyyysw@sina.com

产品名称: **Aleplasinin**
CAS 号: **481629-87-2**
产品货号: **S89481**

生物活性:

Description	Aleplasinin (PAZ-417) 是一种口服有效的、可透过血脑屏障的、选择性的 SERPINE1 (PAI-1, 纤溶酶原激活物抑制剂-1) 抑制剂 (IC50=655 nM)。Aleplasinin 通过抑制 PAI-1 来激活组织型纤溶酶原激活物 (tPA)/纤溶酶蛋白水解级联反应, 从而促进 β-淀粉样蛋白 (Aβ) 寡聚体和单体的降解。Aleplasinin 可显著降低血浆和脑内 Aβ 水平, 改善记忆缺陷并逆转认知障碍。Aleplasinin 可用于阿尔茨海默病的研究。				
IC50 & Target	PAI-1 655 nM (IC50)				
In Vitro	Aleplasinin (5 μM) 在体外使用重组人 PAI-1、纯化 tPA 和纤溶酶原蛋白的实验中, 可恢复 PAI-1 抑制的单体和寡聚 Aβ 42 的切割, 切割恢复率达 93%[1]				
In Vivo	Aleplasinin (20 mg/kg, 口服, 单次) 可降低 Tg2576 转基因小鼠 (阿尔茨海默病模型) 血浆 Aβ 40 和脑 Aβ 40/42, 而 30-100 mg/kg (口服) 可逆转 Tg2576/PSAPP 小鼠海马长时程增强 (LTP) 缺陷, 并改善情境记忆障碍[1]				
	Animal Model:	Tg2576 transgenic mice (male, 20-week-old, expressing human APPSwedish mutation), Alzheimer's disease model[1]			
	Dosage:	20 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage, single dose, 6 h prior to euthanasia.			
	Result:	Decreased plasma Aβ40 by 26% (p<0.001), brain Aβ40 and reduced Aβ42 by 22% and 21%, respectively.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (587.52 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	2.3501 mL	11.7503 mL	23.5007 mL
		5 mM	0.4700 mL	2.3501 mL	4.7001 mL
		10 mM	0.2350 mL	1.1750 mL	2.3501 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 (protect from light)。-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					



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

	Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.89 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.89 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.89 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Jacobsen JS, et al. Enhanced clearance of Aβ in brain by sustaining the plasmin proteolysis cascade. Proc Natl Acad Sci U S A. 2008 Jun 24;105(25):8754-9. [2]. Kellici TF, et al. Therapeutic Potential of Targeting Plasminogen Activator Inhibitor-1 in COVID-19. Trends Pharmacol Sci. 2021 Jun;42(6):431-433.

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 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month (protect from light)。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ 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	2.3501 mL	11.7503 mL	23.5007 mL	58.7516 mL
	5 mM	0.4700 mL	2.3501 mL	4.7001 mL	11.7503 mL
	10 mM	0.2350 mL	1.1750 mL	2.3501 mL	5.8752 mL
	15 mM	0.1567 mL	0.7834 mL	1.5667 mL	3.9168 mL
	20 mM	0.1175 mL	0.5875 mL	1.1750 mL	2.9376 mL
	25 mM	0.0940 mL	0.4700 mL	0.9400 mL	2.3501 mL



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: shyysw@sina.com

	30 mM	0.0783 mL	0.3917 mL	0.7834 mL	1.9584 mL
	40 mM	0.0588 mL	0.2938 mL	0.5875 mL	1.4688 mL
	50 mM	0.0470 mL	0.2350 mL	0.4700 mL	1.1750 mL
	60 mM	0.0392 mL	0.1958 mL	0.3917 mL	0.9792 mL
	80 mM	0.0294 mL	0.1469 mL	0.2938 mL	0.7344 mL
	100 mM	0.0235 mL	0.1175 mL	0.2350 mL	0.5875 mL



源叶