



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: **Fuzapladib**

CAS 号: **141283-87-6**

产品货号: **S89790**

生物活性:

Description	Fuzapladib (IS-741), an orally active leukocyte-function-associated antigen type 1 (LFA-1) activation inhibitor, is a leukocyte adhesion molecule. Fuzapladib is also a phospholipase A2 (PLA2) inhibitor. Fuzapladib exerts anti-inflammatory effects by inhibiting leukocyte migration into the inflammatory site[1][2].				
In Vitro	Fuzapladib (IS-741) (1 μM, 3 h) 在脂多糖刺激下, 可显著抑制 HL-60 细胞与 HUVEC 的粘附[3]。				
In Vivo	Fuzapladib (IS-741) (p.o., 50 mg/kg, 7 days) 抑制中性粒细胞浸润炎症病变, 对减轻大鼠三硝基苯磺酸 (TNBS) 回肠炎有效[4]。				
	Animal Model:	Rats[4]			
	Dosage:	50 mg/kg			
	Administration:	P.o.; for 7 days			
	Result:	Significantly reduced myeloperoxidase (MPO) activity and mucosal IL-8 levels in rat ileum, reduced polymorphonuclear cells and Mac-1 positivity Infiltration of cells into inflammatory lesions, effectively alleviated trinitrobenzenesulfonic acid (TNBS)-induced ileitis.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (263.57 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	2.6357 mL	13.1787 mL	26.3574 mL
		5 mM	0.5271 mL	2.6357 mL	5.2715 mL
		10 mM	0.2636 mL	1.3179 mL	2.6357 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.59 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。 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 (6.59 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]. Noriyuki Kaji, et al. Fuzapladib reduces postsurgical inflammation in the intestinal muscularis externa. J Vet Med Sci. 2023 Sep 21. [2]. C Bassi. IS-741 (Ishihara Sangyo). Curr Opin Investig Drugs. 2001 Apr;2(4):510-2. [3]. Shikama H, et al. Effect of IS-741 on cell adhesion between human umbilical vein endothelial cells and HL-60 cells. Biol Pharm Bull. 1999 Feb;22(2):127-31. [4]. Tetsuya Fukunaga, et al. A novel diamino-pyridine derivative (IS-741) attenuates rat ileitis induced by trinitrobenzene sulfonic acid. J Gastroenterol. 2003;38(5):451-9.

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 (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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.6357 mL	13.1787 mL	26.3574 mL	65.8935 mL
	5 mM	0.5271 mL	2.6357 mL	5.2715 mL	13.1787 mL
	10 mM	0.2636 mL	1.3179 mL	2.6357 mL	6.5894 mL
	15 mM	0.1757 mL	0.8786 mL	1.7572 mL	4.3929 mL
	20 mM	0.1318 mL	0.6589 mL	1.3179 mL	3.2947 mL
	25 mM	0.1054 mL	0.5271 mL	1.0543 mL	2.6357 mL
	30 mM	0.0879 mL	0.4393 mL	0.8786 mL	2.1965 mL
	40 mM	0.0659 mL	0.3295 mL	0.6589 mL	1.6473 mL
	50 mM	0.0527 mL	0.2636 mL	0.5271 mL	1.3179 mL
	60 mM	0.0439 mL	0.2196 mL	0.4393 mL	1.0982 mL
	80 mM	0.0329 mL	0.1647 mL	0.3295 mL	0.8237 mL
	100 mM	0.0264 mL	0.1318 mL	0.2636 mL	0.6589 mL