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

产品名称：Alvelestat
产品别名：AZD9668

生物活性：

Description	Alvelestat (AZD9668) is an orally bioavailable, affinity and selective inhibitor of neutrophil elastase (NE) with a pIC50 value of 7.9 nM, a Ki value of 9.4 nM and a Kd value of 9.5 nM[1].
IC_{50} & Target	pIC: 7.9 nM; Ki: 9.4 nM; Kd: 9.5 nM (neutrophil elastas)[1]
In Vitro	Alvelestat (20 μg/mL; 16 hours; HBE and A549 cells) treatment decreases cells death and decreases the levels of IL-1β, IL-6, and TNF-α in vitro[2].

Cell Viability Assay[2]	
Cell Line:	Human bronchial epithelial cells (HBE) and human alveolar epithelial cells (A549)
Concentration:	20 μg/mL
Incubation Time:	16 hours
Result:	Decreased cytotoxicity and inflammatory responses.

In Vivo	Alvelestat (1-10 mg/kg; oral administration; twice daily; for 4 days; Female BALB/cJBomTac mice) treatment reduces the inflammatory response to cigarette smoke as indicated by a reduction in BAL neutrophils and interleukin-1β[1].
Animal Model:	Female BALB/cJBomTac mice exposed to smoke cigarette smoke[1]
Dosage:	1 mg/kg , 3 mg/kg , 6 mg/kg , 10 mg/kg
Administration:	Oral administration; twice daily; for 4 days
Result:	Reduced the inflammatory response to cigarette smoke as indicated by a reduction in BAL neutrophils and interleukin-1β.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO： ≥ 33 mg/mL (60.49 mM)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.8331 mL	9.1654 mL	18.3308 mL
	5 mM	0.3666 mL	1.8331 mL	3.6662 mL
	10 mM	0.1833 mL	0.9165 mL	1.8331 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 (4.58 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.58 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 (4.58 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.58 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 (4.58 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.58 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]. Stevens T, et al. AZD9668: pharmacological characterization of a novel oral inhibitor of neutrophil elastase. J Pharmacol Exp Ther. 2011 Oct;339(1):313-20. [2]. Li H, et al. Neutrophil extracellular traps contribute to the pathogenesis of acid-aspiration-induced ALI/ARDS. Oncotarget. 2017 Nov 28;9(2):1772-1784.