



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: **NDI-091143**
CAS 号: **2375840-87-0**
产品货号: **S87649**

生物活性:

Description	NDI-091143 是一种有效的高亲和力人 ATP 柠檬酸裂解酶 (ACLY) 抑制剂, IC50 为 2.1 nM (ADP-Glo 分析), Ki 为 7.0 nM, Kd 为 2.2 nM。NDI-091143 通过稳定柠檬酸盐中的大构象变化来间接抑制柠檬酸的结合和识别, 从而抑制了 ACLY 催化变构反应。			
IC50 & Target	IC50: 2.1 nM (human ATP-citrate lyase); Ki: 7.0 nM (human ATP-citrate lyase); Kd: 2.2 nM (human ATP-citrate lyase)[1]			
In Vitro	热位移分析表明, NDI-091143 可显著稳定全长 ACLY 及其 N 端片段。热位移数据与使用全长 ACLY 进行的有限蛋白水解实验结果一致, 其中 NDI-091143 与 Mg-ATP 联用可最大程度地防止糜蛋白酶的消化[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (220.34 mM); 超声助溶 (<60°C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
	Solvent / Mass / Concentration Preparing Stock Solutions	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.2034 mL	11.0171 mL	22.0342 mL
	5 mM	0.4407 mL	2.2034 mL	4.4068 mL
	10 mM	0.2203 mL	1.1017 mL	2.2034 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, 1 year; -20°C, 6 months。 -80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.58 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.58 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: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.58 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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]. Wei J, et al. An allosteric mechanism for potent inhibition of human ATP-citrate lyase. Nature. 2019 Apr;568(7753):566-570.

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 , 1 year; -20°C , 6 months. -80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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	2.2034 mL	11.0171 mL	22.0342 mL	55.0855 mL
	5 mM	0.4407 mL	2.2034 mL	4.4068 mL	11.0171 mL
	10 mM	0.2203 mL	1.1017 mL	2.2034 mL	5.5085 mL
	15 mM	0.1469 mL	0.7345 mL	1.4689 mL	3.6724 mL
	20 mM	0.1102 mL	0.5509 mL	1.1017 mL	2.7543 mL
	25 mM	0.0881 mL	0.4407 mL	0.8814 mL	2.2034 mL
	30 mM	0.0734 mL	0.3672 mL	0.7345 mL	1.8362 mL
	40 mM	0.0551 mL	0.2754 mL	0.5509 mL	1.3771 mL
	50 mM	0.0441 mL	0.2203 mL	0.4407 mL	1.1017 mL
	60 mM	0.0367 mL	0.1836 mL	0.3672 mL	0.9181 mL
	80 mM	0.0275 mL	0.1377 mL	0.2754 mL	0.6886 mL
	100 mM	0.0220 mL	0.1102 mL	0.2203 mL	0.5509 mL