



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: **AC1903**
CAS 号: **831234-13-0**
产品货号: **S89142**

生物活性:	
Description	AC1903 是 TRPC5 的特异性选择性抑制剂, 具有足细胞保护特性。AC1903 对 TRPC4 或 TRPC6 current 没有影响, 并且在激酶谱分析中没有显示出脱靶效应。在局灶节段性肾小球硬化 (FSGS) 大鼠模型中, AC1903 抑制严重蛋白尿, 并且防止足细胞丢失。
IC50 & Target	IC50: 14.7 μ M (TRPC5 current IN HEK-293 cells)[1]
In Vitro	TRPC5 是一种 Ca^{2+} 渗透性非选择性的阳离子通道, 在大脑和肾脏中高表达。 AC1903 (0-100 μ M) 阻断利鲁唑激活的 TRPC5 全细胞电流, 但不能阻断卡巴胆碱 (CCh) -诱导的 TRPC4 和 OAG 诱导的 TRPC6 电流, 即使在膜片钳电生理学实验中处于高微摩尔浓度。ML204 的 IC50 值 (IC50 =13.6 μ M) 和 AC1903 (IC50=14.7 μ M) 在表达 TRPC5 的人胚肾 293 (HEK-293) 细胞中几乎等效[1]。 AC1903 (30 μ M) 抑制血管紧张素 II 诱导的野生型足细胞和表达不能被灭活和内吞的突变血管紧张素 II 1 型 (AT1) 受体的足细胞中活性氧 (ROS) 的产生[1]。 AC1903 (30 μ M) 阻断 Ca^{2+} AT1R 诱导的 ROS 生成。观察到 Ca^{2+} AT1R 表达后 36 小时内足细胞死亡增加, 但 AC1903 可保护足细胞免于细胞死亡[1]。
	Cell Viability Assay[1]
	Cell Line: Podocyte cells
	Concentration: 30 μ M
	Incubation Time: 36 hours
	Result: Rescued podocyte cell death.
In Vivo	AC1903 (腹腔注射; 50 mg/kg; 每天两次; 7 天) 显著抑制肾病 AT1 受体转基因大鼠模型中的蛋白尿并减少假性囊肿形成和足细胞丢失[1]。 AC1903 (腹腔注射; 50 mg/kg; 每天两次; 在第 7 天开始并处理 1 周直至第 14 天) 在第 7 天开始显示显著抑制蛋白尿, 足细胞数量保持不变。此外, AC1903 不影响平均动脉压 (MAP), 对 Dahl S 大鼠的体重、血尿素氮或肌酐没有影响[1]。
	Animal Model: Hypertension-induced focal segmental glomerulosclerosis (FSGS) model in Dahl salt-sensitive rats[1]
	Dosage: 50 mg/kg
	Administration: Intraperitoneal injection; 50 mg/kg; twice per day; 7 days
	Result: Inhibited the progression of proteinuric kidney disease by preserving podocytes.
	Animal Model: 6-week-old Dahl S rats received 2% NaCl for 1 week with severe, progressive proteinuric disease[1]
	Dosage: 50 mg/kg
	Administration: Intraperitoneal injection; 50 mg/kg; twice per day; initiated on day 7 and treated for 1 week until day 14
	Result: Decreased the rate of proteinuria when administered at the beginning of a high-salt diet and prevents progression when administered one week following initiation of a high-salt diet.
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (329.64 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	3.2964 mL	16.4821 mL	32.9641 mL
	5 mM	0.6593 mL	3.2964 mL	6.5928 mL
	10 mM	0.3296 mL	1.6482 mL	3.2964 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.24 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。 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；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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.24 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]. Yiming Zhou, et al. A small-molecule inhibitor of TRPC5 ion channels suppresses progressive kidney disease in animal models. Science.			

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。

可选溶剂	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 / 浓度				



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

DMSO	1 mM	3.2964 mL	16.4821 mL	32.9641 mL	82.4103 mL
	5 mM	0.6593 mL	3.2964 mL	6.5928 mL	16.4821 mL
	10 mM	0.3296 mL	1.6482 mL	3.2964 mL	8.2410 mL
	15 mM	0.2198 mL	1.0988 mL	2.1976 mL	5.4940 mL
	20 mM	0.1648 mL	0.8241 mL	1.6482 mL	4.1205 mL
	25 mM	0.1319 mL	0.6593 mL	1.3186 mL	3.2964 mL
	30 mM	0.1099 mL	0.5494 mL	1.0988 mL	2.7470 mL
	40 mM	0.0824 mL	0.4121 mL	0.8241 mL	2.0603 mL
	50 mM	0.0659 mL	0.3296 mL	0.6593 mL	1.6482 mL
	60 mM	0.0549 mL	0.2747 mL	0.5494 mL	1.3735 mL
	80 mM	0.0412 mL	0.2060 mL	0.4121 mL	1.0301 mL
	100 mM	0.0330 mL	0.1648 mL	0.3296 mL	0.8241 mL

源叶