



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: **ACH-000143**
CAS 号: **2225836-30-4**
产品货号: **S89215**

生物活性:

Description	ACH-000143 是有效的、具有口服活性的褪黑素受体的激动剂, 对 MT1 和 MT2 的 EC50 值分别为 0.06 nM 和 0.32 nM。				
IC50 & Target[1]	MT1		MT2		
	0.06 nM (EC50)		0.32 nM (EC50)		
In Vivo	ACH-000143 reduces liver triglycerides and steatosis in diet-Induced obese rats[1].				
	ACH-000143 is devoid of hERG binding, genotoxicity, and behavioral alterations at doses up to 100 mg/kg p.o., supporting further investigation of this compound as a drug candidate[1].				
	ACH-000143 significantly reduces plasma glucose at 10 mg/kg (16.4%, p < 0.05) and 30 mg/kg (16.9%, p < 0.01)[1]。				
	Animal Model:	High-fat diet rats[1].			
	Dosage:	10 and 30 mg/kg.			
	Administration:	Orally, once daily for two months.			
Result:	Significantly reduced the weekly BW gain on weeks.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (167.93 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	3.3586 mL	16.7932 mL	33.5864 mL
		5 mM	0.6717 mL	3.3586 mL	6.7173 mL
10 mM		0.3359 mL	1.6793 mL	3.3586 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 Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.40 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.40 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 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.40 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]. Marcos Antonio Ferreira Jr, et al. Discovery of ACH-000143: A Novel Potent and Peripherally Preferred Melatonin Receptor Agonist that Reduces Liver Triglycerides and Steatosis in Diet-Induced Obese Rats. J Med Chem. 2021 Feb 25;64(4):1904-1929.

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	3.3586 mL	16.7932 mL	33.5864 mL	83.9659 mL
	5 mM	0.6717 mL	3.3586 mL	6.7173 mL	16.7932 mL
	10 mM	0.3359 mL	1.6793 mL	3.3586 mL	8.3966 mL
	15 mM	0.2239 mL	1.1195 mL	2.2391 mL	5.5977 mL
	20 mM	0.1679 mL	0.8397 mL	1.6793 mL	4.1983 mL
	25 mM	0.1343 mL	0.6717 mL	1.3435 mL	3.3586 mL
	30 mM	0.1120 mL	0.5598 mL	1.1195 mL	2.7989 mL
	40 mM	0.0840 mL	0.4198 mL	0.8397 mL	2.0991 mL
	50 mM	0.0672 mL	0.3359 mL	0.6717 mL	1.6793 mL
	60 mM	0.0560 mL	0.2799 mL	0.5598 mL	1.3994 mL
	80 mM	0.0420 mL	0.2099 mL	0.4198 mL	1.0496 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

	100 mM	0.0336 mL	0.1679 mL	0.3359 mL	0.8397 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶