



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: shyyw@sina.com

产品名称: UCT943
CAS 号: 1450666-80-4
产品货号: S89611

生物活性:

Description	UCT943 是新一代恶性疟原虫 Plasmodium falciparum PI4K 抑制剂。UCT943 抑制 P. vivax PI4K (PvPI4K) 酶, IC50 为 23 nM。				
IC50 & Target[1]	PvPI4K	Plasmodium			
	23 nM (IC50)				
In Vitro	UCT943 maintains high in vitro selectivity (>200-fold) for the parasite PvPI4K versus the human PI4K β isozyme (IC50 of PI4K β , 5.4 μ M), inhibition of which is linked to immunosuppressive effects[1]. In vitro cytotoxicity of UCT943 is tested against L6 cells, chinese hamster ovarian (CHO), Vero, and HepG2 cells, with 50% cytotoxic concentrations (CC50s) of 12, 17, 113, and 13 μ M, respectively[1]。				
In Vivo	UCT943 shows excellent in vivo efficacy in the Plasmodium berghei (10 mg/kg and 3 mg/kg; oral administration; daily; 4 days) and P. falciparum NSG (NOD-scid IL-2R γ null) mouse models (0.01, 0.1, 0.3, 1.1 and 10 mg/kg; oral administration; once per day; 4 days). When dosed at 10 mg/kg per os (p.o.), UCT943 reduces parasitemia by >99.9% in the mouse P. berghei infection model and cures all mice, with >30 mean survival days (MSD). At 3 mg/kg p.o., no complete cure is achieved, and MSD is 10 days, albeit parasitemia is reduced by 99%. The resulting 90% effective dose (ED90) is 1.0 mg/kg p.o. in the P. berghei infection model. The ED90 is 0.25 mg/kg in the P. falciparum-infected NSG mouse model[1].				
	Animal Model:	Mice with P. berghei and P. falciparum NOD-scid IL-2Rγnull (NSG) models[1]			
	Dosage:	10 mg/kg and 3 mg/kg for P. berghei model; 0.01, 0.1, 0.3, 1.1 and 10 mg/kg for P. falciparum NOD-scid IL-2Rγnull (NSG) model			
	Administration:	Oral administration; daily; 4 days for P. berghei model Oral administration; once per day; 4 days for P. falciparum NOD-scid IL-2Rγnull (NSG) model			
	Result:	The ED90 is 1.0 mg/kg in the P. berghei infection model. The ED90 is 0.25 mg/kg in the P. falciparum-infected NSG mouse model.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (584.90 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	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.3396 mL	11.6981 mL	23.3962 mL
		5 mM	0.4679 mL	2.3396 mL	4.6792 mL
		10 mM	0.2340 mL	1.1698 mL	2.3396 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。 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 (4.87 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 (4.87 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.87 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，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]. Brunschwig C, et al. UCT943, a Next-Generation Plasmodium falciparum PI4K Inhibitor Preclinical Candidate for the Treatment of Malaria. Antimicrob Agents Chemother. 2018 Aug 27;62(9). pii: e00012-18.

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。-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	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积				
	浓度				
DMSO	1 mM	2.3396 mL	11.6981 mL	23.3962 mL	58.4905 mL
	5 mM	0.4679 mL	2.3396 mL	4.6792 mL	11.6981 mL
	10 mM	0.2340 mL	1.1698 mL	2.3396 mL	5.8490 mL
	15 mM	0.1560 mL	0.7799 mL	1.5597 mL	3.8994 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

	20 mM	0.1170 mL	0.5849 mL	1.1698 mL	2.9245 mL
	25 mM	0.0936 mL	0.4679 mL	0.9358 mL	2.3396 mL
	30 mM	0.0780 mL	0.3899 mL	0.7799 mL	1.9497 mL
	40 mM	0.0585 mL	0.2925 mL	0.5849 mL	1.4623 mL
	50 mM	0.0468 mL	0.2340 mL	0.4679 mL	1.1698 mL
	60 mM	0.0390 mL	0.1950 mL	0.3899 mL	0.9748 mL
	80 mM	0.0292 mL	0.1462 mL	0.2925 mL	0.7311 mL
	100 mM	0.0234 mL	0.1170 mL	0.2340 mL	0.5849 mL



源叶