



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: **DGAT-3; T863**
CAS 号: **701232-20-4**
产品货号: **S86263**

生物活性:					
Description		T863 是一种具有口服活性、选择性且有效的 DGAT1（酰基辅酶 A: 二酰基甘油酰基转移酶 1）抑制剂, IC50 为 15 nM。T863 对人 MGAT3、人 DGAT2 或人 MGAT2 无抑制活性。T863 与 DGAT1 的酰基辅酶 A 结合位点相互作用, 抑制细胞中三酰基甘油的合成。			
IC50 & Target		IC50: 15 nM (DGAT1)[2]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	CHO-K1	EC50	1.436 μM	Inhibition of human DGAT1 expressed in CHO-K1 cells after 1 hr using palmitoyl-1-14C-coenzyme A by phospholipid flashplate assay	
	HT-29	IC50	16 nM	Inhibition of DGAT1-mediated triglyceride synthesis in human HT-29 cells using [3H]glycerol as substrate after 6 hrs by beta counting	
	HT-29	IC50	8 nM	Inhibition of human DGAT-1-mediated triglyceride synthesis in the HT-29 cells by whole cell assay	
	HuTu80	IC50	0.004 μM	Inhibition of triacylglycerol synthesis in human HuTu 80 cells after 30 mins	
	Sf9	IC50	0.015 μM	Inhibition of human recombinant DGAT1 expressed in Sf9 cells by liquid scintillography	
	Sf9	IC50	72 nM	Inhibition of full length human microsomal DGAT-1 expressed in baculovirus infected insect Sf9 cells using [14C]decanoylCoA as substrate after 1.5 hrs by scintillation counting	
In Vitro		T863（持续 3 天）增强胰岛素刺激的葡萄糖摄取，表明脂肪细胞可能在分化的 3T3-L1 脂肪细胞中抑制 DGAT1 后提高胰岛素敏感性[1]。			
In Vivo	T863（30 mg/kg; 口服）可致体重减轻、血清和肝脏甘油三酯降低，并改善胰岛素敏感性[1]。				
	Animal Model:		C57BL6 normal mice (8 weeks old) or diet-induced obese (DIO) mice (10 months old, fed a high fat diet for 8 months)[1]		
	Dosage:		30 mg/kg (5 μL/g)		
	Administration:		Oral administration; once a day for days 1-7 and twice a day for days 8-14		
	Result:		Significantly delayed fat absorption and resulted in lipid accumulation in the distal small intestine of mice, mimicking the effects of genetic ablation of DGAT1		
Solvent&Solubility		细胞实验:			
		DMSO 中的溶解度 : ≥ 50 mg/mL (126.75 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown			
		Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg



	Preparing	1 mM	2.5350 mL	12.6752 mL	25.3505 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.5070 mL	2.5350 mL	5.0701 mL
		10 mM	0.2535 mL	1.2675 mL	2.5350 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.34 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]. Cao J, et al. Targeting Acyl-CoA:diacylglycerol acyltransferase 1 (DGAT1) with small molecule inhibitors for the treatment of metabolic diseases. J Biol Chem. 2011 Dec 2;286(48):41838-51. [2]. Alan M Birch, et al. Discovery of a potent, selective, and orally efficacious pyrimidinooxazinylic bicyclooctaneacetic acid diacylglycerol acyltransferase-1 inhibitor. J Med Chem. 2009 Mar 26;52(6):1558-68.				
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℃, 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。					
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.5350 mL	12.6752 mL	25.3505 mL	63.3762 mL
	5 mM	0.5070 mL	2.5350 mL	5.0701 mL	12.6752 mL
	10 mM	0.2535 mL	1.2675 mL	2.5350 mL	6.3376 mL
	15 mM	0.1690 mL	0.8450 mL	1.6900 mL	4.2251 mL
	20 mM	0.1268 mL	0.6338 mL	1.2675 mL	3.1688 mL
	25 mM	0.1014 mL	0.5070 mL	1.0140 mL	2.5350 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

	30 mM	0.0845 mL	0.4225 mL	0.8450 mL	2.1125 mL
	40 mM	0.0634 mL	0.3169 mL	0.6338 mL	1.5844 mL
	50 mM	0.0507 mL	0.2535 mL	0.5070 mL	1.2675 mL
	60 mM	0.0423 mL	0.2113 mL	0.4225 mL	1.0563 mL
	80 mM	0.0317 mL	0.1584 mL	0.3169 mL	0.7922 mL
	100 mM	0.0254 mL	0.1268 mL	0.2535 mL	0.6338 mL



源叶