



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: **PF-06446846 hydrochloride**

CAS 号: **1632250-50-0**

产品货号: **S89119**

生物活性:

Description	PF-06446846 hydrochloride 是一种具有口服活性, 高选择性前蛋白转化酶枯草杆菌蛋白酶/kexin 9 型 (PCSK9) 的翻译抑制剂。PF-06446846 hydrochloride 可通过诱导核糖体停在密码子 34 周围, 从而抑制 PCSK9。				
IC50 & Target	PCSK9[1]				
In Vitro	PF-06446846 hydrochloride 抑制 Huh7 细胞分泌 PCSK9, IC50 为 0.3 μM[1]。				
In Vivo	PF-06446846 hydrochloride (口服强饲法; 5-50 mg/kg/天, 持续 14 天) 以剂量依赖性方式降低血浆 PCSK9 并降低总胆固醇水平[1]。				
	Animal Model:	Male Sprague-Dawley (CrI:CD [SD] rats, 6-8 wk old at initiation of dosing)[1]			
	Dosage:	5, 15, and 50 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage; daily for 14 days			
	Result:	Lowered plasma PCSK9 in a dose-dependent manner and lowered total cholesterol levels.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	H2O 中的溶解度 : 100 mg/mL (212.61 mM; 超声助溶)				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (212.61 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1261 mL	10.6304 mL	21.2608 mL
		5 mM	0.4252 mL	2.1261 mL	4.2522 mL
		10 mM	0.2126 mL	1.0630 mL	2.1261 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, 2 years; -20°C, 1 year (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。				
	* 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。				
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% (20% SBE-β-CD in Saline)					
Solubility: ≥ 5 mg/mL (10.63 mM); 澄清溶液					
此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。					
以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 5 mg/mL (10.63 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 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 50.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.42 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。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。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: PBS Solubility: 100 mg/mL (212.61 mM); 澄清溶液; 超声助溶 (<60°C)。
参考文献	[1]. Lintner NG, et al. Selective stalling of human translation through small-molecule engagement of the ribosome nascent chain. PLoS Biol. 2017 Mar 21;15(3):e2001882.

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 (sealed storage, away from moisture)。-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 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
H ₂ O / DMSO	1 mM	2.1261 mL	10.6304 mL	21.2608 mL	53.1519 mL
	5 mM	0.4252 mL	2.1261 mL	4.2522 mL	10.6304 mL
	10 mM	0.2126 mL	1.0630 mL	2.1261 mL	5.3152 mL
	15 mM	0.1417 mL	0.7087 mL	1.4174 mL	3.5435 mL
	20 mM	0.1063 mL	0.5315 mL	1.0630 mL	2.6576 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

	25 mM	0.0850 mL	0.4252 mL	0.8504 mL	2.1261 mL
	30 mM	0.0709 mL	0.3543 mL	0.7087 mL	1.7717 mL
	40 mM	0.0532 mL	0.2658 mL	0.5315 mL	1.3288 mL
	50 mM	0.0425 mL	0.2126 mL	0.4252 mL	1.0630 mL
	60 mM	0.0354 mL	0.1772 mL	0.3543 mL	0.8859 mL
	80 mM	0.0266 mL	0.1329 mL	0.2658 mL	0.6644 mL
	100 mM	0.0213 mL	0.1063 mL	0.2126 mL	0.5315 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶