



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

产品名称: 4-[4-(4-氨基-7,7-二甲基-7H-嘧啶并[4,5-B][1,4]噁唑-6-基)苯基]双环[2.2.2]辛烷-1-乙酸
产品别名: DGAT-1 inhibitor 2

生物活性:				
Description	DGAT-1 inhibitor 2 is an effective inhibitor of DGAT-1; antiobesity agents. IC50 value: Target: DGAT-1 Acyl-CoA:diacylglycerol acyltransferase 1 (DGAT1) is one of two known DGAT enzymes that catalyze the final step in triglyceride synthesis. Findings from genetically modified mice as well as pharmacological studies suggest that inhibition of DGAT1 is a promising strategy for the treatment of obesity and type 2 diabetes.			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : 25 mg/mL (59.45 mM; Need ultrasonic)			
		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
	Preparing	1 mM	2.3781 mL	11.8906 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4756 mL	2.3781 mL
		10 mM	0.2378 mL	1.1891 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。			
	In Vivo: 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 1.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: 2.5 mg/mL (5.95 mM); Suspended solution; Need ultrasonic 此方案可获得 2.5 mg/mL (5.95 mM)的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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, 向上述体系中加入 50 µL Tween-80, 混合均匀; 然后继续加入 450 µL 生理盐水定容至 1 mL。 2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.95 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.95 mM, 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。 3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.95 mM); Clear solution			



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

	此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.95 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 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。
References	[1]. Matsuda D, Tomoda H. DGAT inhibitors for obesity. Curr Opin Investig Drugs. 2007 Oct;8(10):836-41. [2]. Birch, Alan M.; Birtles, Susan; Buckett, Linda K. et al. Discovery of a Potent, Selective, and Orally Efficacious Pyrimidinooxaziny Bicyclooctaneacetic Acid Diacylglycerol Acyltransferase-1 Inhibitor. Journal of Medicinal Chemistry (2009), 52(6), 1558-1568. [3]. King AJ, Judd AS, Souers AJ. Inhibitors of diacylglycerol acyltransferase: a review of 2008 patents. Expert Opin Ther Pat. 2010 Jan;20(1):19-29. [4]. Cao J, Zhou Y, Peng H 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.

源叶生物