产品名称：**PF-04620110**
产品别名：**PF-04620110**

生物活性：

Description	PF-04620110 is a potent, selective and orally bioavailable diglyceride acyltransferase-1 (DGAT-1) inhibitor with an IC50 of 19 nM[1].
IC_{50} & Target	IC50: 19 nM (DGAT-1)[1]
In Vitro	PF-04620110 is orally bioavailable, has passive permeability($1x10^{-6}$ cm/s)[1]. PF-04620110 inhibits DGAT-1 with an IC50 of 19 nM, and inhibits triglyceride synthesis with an IC50 of 8 nM in HT-29 cells[2]. PF-04620110 is a highly selective inhibitor of DGAT-1 with >100-fold selectivity against a panel of lipid processing enzymes (human DGAT-2, several human acyl-CoA: cholesterol acyltransferase-1, wax alcohol acyltransferase-1/-2 and monacylglycerol acyltransferase-2/-3, and mouse MGAT-1)[2].
In Vivo	PF-04620110 (0.1-10 mg/kg; p.o.) reduces plasma triglyceride levels at doses of ≥0.1 mg/kg following a lipid challenge in rat[2].

Animal Model:	Sprague−Dawley rats[2]
Dosage:	0.1 mg/kg, 1 mg/kg, 10 mg/kg
Administration:	Oral administration
Result:	Produced a statistically significant reduction in plasma triglyceride excursion at 2 hours to near prelipid load levels.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : 12.5 mg/mL (31.53 mM; Need ultrasonic)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.5224 mL	12.6122 mL	25.2245 mL
	5 mM	0.5045 mL	2.5224 mL	5.0449 mL
	10 mM	0.2522 mL	1.2612 mL	2.5224 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: 1.25 mg/mL (3.15 mM); Suspended solution; Need ultrasonic

此方案可获得 1.25 mg/mL (3.15 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 12.5 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: ≥ 1.25 mg/mL (3.15 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (3.15 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 12.5 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: ≥ 1.25 mg/mL (3.15 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (3.15 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 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
References	[1]. Dow RL, et al. Design and synthesis of potent, orally-active DGAT-1 inhibitors containing a dioxino[2,3-d]pyrimidine core. Bioorg Med Chem Lett. 2011 Oct 15;21(20):6122-5. [2]. Dow RL, et al. Discovery of PF-04620110, a Potent, Selective, and Orally Bioavailable Inhibitor of DGAT-1. ACS Med Chem Lett. 2011 Mar 18;2(5):407-12.