



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: **PF-04971729**
产品别名: 埃格列净; **Ertugliflozin**

生物活性:				
Description	Ertugliflozin (PF-04971729) is a potent, selective and orally active inhibitor of the sodium-dependent glucose cotransporter 2 (SGLT2), with an IC ₅₀ of 0.877 nM for h-SGLT2[1]. A drug for the treatment of type 2 diabetes mellitus[2].			
IC ₅₀ & Target	IC ₅₀ : 0.877 nM (h-SGLT2)[1].			
In Vitro	Ertugliflozin (PF-04971729) demonstrates >2000-fold selectivity for SGLT2 inhibition (relative to SGLT1) in vitro[3].			
In Vivo	Ertugliflozin (PF-04971729) reveals a concentration-dependent glucosuria after oral administration to rats[3].			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 46 mg/mL (105.29 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.2890 mL	11.4448 mL
		5 mM	0.4578 mL	2.2890 mL
		10 mM	0.2289 mL	1.1445 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 (5.72 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.72 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 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 (5.72 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.72 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 生理盐水溶液中, 混合均匀。			



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

	<p>3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.72 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.72 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。</p> <p>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。</p>
References	<p>[1]. Mascitti V, et al. Discovery of a clinical candidate from the structurally unique dioxo-bicyclo[3.2.1]octane class of sodium-dependent glucose cotransporter 2 inhibitors. J Med Chem. 2011 Apr 28;54(8):2952-60.</p> <p>[2]. Miao Z, et al. Pharmacokinetics, metabolism, and excretion of the antidiabetic agent ertugliflozin (PF-04971729) in healthy male subjects. Drug Metab Dispos. 2013 Feb;41(2):445-56.</p> <p>[3]. Kalgutkar AS, et al. Preclinical species and human disposition of PF-04971729, a selective inhibitor of the sodium-dependent glucose cotransporter 2 and clinical candidate for the treatment of type 2 diabetes mellitus. Drug Metab Dispos. 2011 Sep;39(9):1609-19.</p>

源叶生物