



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: **ML297**
CAS 号: **1443246-62-5**
产品货号: **S87971**

生物活性:

Description	ML 297 (VU 0456810) 是一种强效、选择性的 GIRK1/2 激活剂, EC50 值为 0.16 μ M。ML 297 能用于癫痫病的研究。				
IC50 & Target	EC50: 0.16 μ M (GIRK1/2), 18 μ M (GIRK1/4)[1]				
In Vitro	ML 297 is completely inactive for GIRK2/3[1]. ML297 shows concentration-dependent efficacy in expressing GIRK1/2 cells and with an EC50 of 162 nM[2]. ML297 shows a complete inability to modulate the activity of HEK-293 cells expressing GIRK2 alone and GIRKGIRK2/3[2].				
In Vivo	ML297 (60 mg/kg; i.p.) shows a highly significant ability to both prevent convulsions and prevent fatality of the PTZ treatment[2].				
	Animal Model:	8-10 months old C57/BL6 male mice (approximately 30 g)[2]			
	Dosage:	60 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection			
	Result:	Most of the animals neither convulsions nor death.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (761.45 mM); 超声助溶; 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	3.0458 mL	15.2290 mL	30.4581 mL
		5 mM	0.6092 mL	3.0458 mL	6.0916 mL
		10 mM	0.3046 mL	1.5229 mL	3.0458 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。				
	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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.34 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.34 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 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.34 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, 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 20.8 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]. Wen W, et al. Discovery of 'molecular switches' within a GIRK activator scaffold that afford selective GIRK inhibitors. Bioorg Med Chem Lett. 2013 Aug 15;23(16):4562-6. [2]. Kaufmann K, et al. ML297 (VU0456810), the first potent and selective activator of the GIRK potassium channel, displays antiepileptic properties in mice. ACS Chem Neurosci. 2013 Sep 18;4(9):1278-86.

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, 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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.0458 mL	15.2290 mL	30.4581 mL	76.1452 mL
	5 mM	0.6092 mL	3.0458 mL	6.0916 mL	15.2290 mL
	10 mM	0.3046 mL	1.5229 mL	3.0458 mL	7.6145 mL
	15 mM	0.2031 mL	1.0153 mL	2.0305 mL	5.0763 mL
	20 mM	0.1523 mL	0.7615 mL	1.5229 mL	3.8073 mL
	25 mM	0.1218 mL	0.6092 mL	1.2183 mL	3.0458 mL
	30 mM	0.1015 mL	0.5076 mL	1.0153 mL	2.5382 mL
	40 mM	0.0761 mL	0.3807 mL	0.7615 mL	1.9036 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

	50 mM	0.0609 mL	0.3046 mL	0.6092 mL	1.5229 mL
	60 mM	0.0508 mL	0.2538 mL	0.5076 mL	1.2691 mL
	80 mM	0.0381 mL	0.1904 mL	0.3807 mL	0.9518 mL
	100 mM	0.0305 mL	0.1523 mL	0.3046 mL	0.7615 mL



源叶