



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: **ML 161**
CAS 号: **423735-93-7**
产品货号: **S88108**

生物活性:

Description	Parmodulin 2 (ML161) 是一种蛋白酶激活受体 1 (PAR1) 变构抑制剂, IC50 为 0.26 μM。 Parmodulin 2 是一种有效的, 非竞争性的 SFLLRN 诱导的 P-selectin 表达抑制剂, 可以抑制体外血小板聚集和体内血小板血栓形成。				
IC50 & Target[1]	PAR1 .26 μM (IC50)				
In Vitro	Parmod μ Lin 2 (ML161; 10 μM; 持续 30 分钟) 抑制内皮 HUVEC 细胞中的促炎信号传导[3]。				
In Vivo	Parmod μ Lin 2 (ML161; 5 mg/kg; IV) 显著抑制血小板血栓形成, AUC (曲线下面积) 抑制率为 73%[2]。 Parmod μ Lin 2 在体内抑制血小板血栓形成, 不延长出血时间。Parmod μ Lin 2 通过 Par1 和 α2A 肾上腺素能受体[2] 选择性地抑制血小板聚集。				
	Animal Model:	C57BL/6J wild type mice[2]			
	Dosage:	5 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)			
	Administration:	IV			
	Result:	Significantly inhibited platelet thrombus formation, with a 73% inhibition in AUC.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (276.83 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	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.7683 mL	13.8416 mL	27.6832 mL
		5 mM	0.5537 mL	2.7683 mL	5.5366 mL
		10 mM	0.2768 mL	1.3842 mL	2.7683 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。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.92 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (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;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。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (6.92 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (6.92 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 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 25.0 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]. Gandhi DM, et al. Characterization of Protease-Activated Receptor (PAR) ligands: Parmodulins are reversible allosteric inhibitors of PAR1-driven calcium mobilization in endothelial cells. Bioorg Med Chem. 2018 May 15;26(9):2514-2529. [2]. Susanna F Gunnink, et al. Allosteric inhibition of protease activated receptor 1: a new antiplatelet therapy. [3]. Aisiku O, et al. Parmodulins inhibit thrombus formation without inducing endothelial injury caused by vorapaxar. Blood. 2015 Mar 19;125(12):1976-85.

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 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year. -80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}$ 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
DMSO	1 mM	2.7683 mL	13.8416 mL	27.6832 mL	69.2080 mL
	5 mM	0.5537 mL	2.7683 mL	5.5366 mL	13.8416 mL
	10 mM	0.2768 mL	1.3842 mL	2.7683 mL	6.9208 mL
	15 mM	0.1846 mL	0.9228 mL	1.8455 mL	4.6139 mL
	20 mM	0.1384 mL	0.6921 mL	1.3842 mL	3.4604 mL
	25 mM	0.1107 mL	0.5537 mL	1.1073 mL	2.7683 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

	30 mM	0.0923 mL	0.4614 mL	0.9228 mL	2.3069 mL
	40 mM	0.0692 mL	0.3460 mL	0.6921 mL	1.7302 mL
	50 mM	0.0554 mL	0.2768 mL	0.5537 mL	1.3842 mL
	60 mM	0.0461 mL	0.2307 mL	0.4614 mL	1.1535 mL
	80 mM	0.0346 mL	0.1730 mL	0.3460 mL	0.8651 mL
	100 mM	0.0277 mL	0.1384 mL	0.2768 mL	0.6921 mL



源叶