



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: **ML221**
CAS 号: **877636-42-5**
产品货号: **S88730**

生物活性:				
Description	ML221 是一种 apelin (APJ) 拮抗剂, 抑制 apelin-13 介导的 APJ 的活化, 在 cAMP 试验和 β -arrestin 实验中, IC ₅₀ 值分别为 0.70 μ M 和 1.75 μ M, EC ₈₀ 值均为 10 nM。			
IC ₅₀ & Target	IC ₅₀ : 1.75 μ M (APJ, cell-based)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	CHO-K1	IC ₅₀	1.75 μ M	Antagonist activity at APJ receptor expressed in CHO-K1 cells assessed as inhibition of apelin13-induced β -arrestin recruitment after 90 mins by luminescence assay
In Vitro	ML221 是一种有效的 apelin/APJ 功能性拮抗剂, 可抑制 apelin-13 介导的 APJ 激活, 在 cAMP 测定中的 IC ₅₀ 为 0.70 μ M, 在 β -arrestin 测定中为 1.75 μ M, 并且两种测定中的 EC ₈₀ 均为 10 nM。ML221 比细胞中密切相关的血管紧张素 II 型 1 (AT1) 受体 (IC ₅₀ , >79 μ M) 的选择性高 37 倍以上。ML221 对一系列 GPCR 表现出有限的交叉反应性, 但 κ -阿片类药物和苯二氮卓受体 (<50/<70%I, 在 10 μ M 时) 除外[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 31 mg/mL (80.45 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.5950 mL	12.9752 mL
		5 mM	0.5190 mL	2.5950 mL
		10 mM	0.2595 mL	1.2975 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2 mg/mL (5.19 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2 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 μ L 20.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 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: shyyssw@sina.com

参考文献

[1]. Maloney PR, et al. Discovery of 4-oxo-6-((pyrimidin-2-ylthio)methyl)-4H-pyran-3-yl 4-nitrobenzoate (ML221) as a functional antagonist of the apelin (APJ) receptor. Bioorg Med Chem Lett. 2012 Nov 1;22(21):6656-60.

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, 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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.5950 mL	12.9752 mL	25.9504 mL	64.8761 mL
	5 mM	0.5190 mL	2.5950 mL	5.1901 mL	12.9752 mL
	10 mM	0.2595 mL	1.2975 mL	2.5950 mL	6.4876 mL
	15 mM	0.1730 mL	0.8650 mL	1.7300 mL	4.3251 mL
	20 mM	0.1298 mL	0.6488 mL	1.2975 mL	3.2438 mL
	25 mM	0.1038 mL	0.5190 mL	1.0380 mL	2.5950 mL
	30 mM	0.0865 mL	0.4325 mL	0.8650 mL	2.1625 mL
	40 mM	0.0649 mL	0.3244 mL	0.6488 mL	1.6219 mL
	50 mM	0.0519 mL	0.2595 mL	0.5190 mL	1.2975 mL
	60 mM	0.0433 mL	0.2163 mL	0.4325 mL	1.0813 mL
	80 mM	0.0324 mL	0.1622 mL	0.3244 mL	0.8110 mL