



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 382**
CAS 号: **1646499-97-9**
产品货号: **S89009**

生物活性:

Description	ML382 是一种有效选择性的 Mas 相关 G 蛋白偶联受体 X1 MRGPRX1 (MrgX1) 正向调节剂, EC50 为 190 nM。				
IC50 & Target	EC50: 190 nM (MRGPRX1)[1]				
In Vitro	In the absence of ML382, the IC50 for BAM8-22 inhibition of ICa is 0.66 ± 0.05 μ M. In the presence of 0.1 μ M, 1 μ M, 10 μ M, and 30 μ M ML382, BAM8-22 IC50 is reduced to 0.43 ± 0.02 μ M, 0.25 ± 0.02 μ M, 0.06 ± 0.01 μ M, and 0.08 ± 0.01 μ M, respectively. A lower IC50 generally indicates a higher potency; thus, ML382 dose-dependently increases the potency of BAM8 - 22, further demonstrating that ML382 is a positive allosteric modulator of MRGPRX1[1]。				
In Vivo	ML382 (5 μM) significantly increases inhibition of ICa by a low concentration of BAM8-22 (0.5 μM) in DRG neurons from MrgprX1 mice. ML382 enhances the inhibition of spinal synaptic transmission by BAM8-22 in MrgprX1 mice. ML382 (25 μM, 125 μM, and 250 μM; 5 μL; i.th.∴) dose-dependently attenuates heat hypersensitivity in MrgprX1 mice. ML382 (lumbar puncture injection; 25 μM, 5 μL) leads to a significant increase in postconditioning time spent in the ML382-paired chamber, compared with the preconditioning value. ML382 inhibits nerve injury-induced ongoing pain in MrgprX1 mice[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (277.45 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	2.7745 mL	13.8723 mL	27.7446 mL
		5 mM	0.5549 mL	2.7745 mL	5.5489 mL
		10 mM	0.2774 mL	1.3872 mL	2.7745 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.94 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。					



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

	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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.94 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, 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]. Li Z, et al. Targeting human Mas-related G protein-coupled receptor X1 to inhibit persistent pain. Proc Natl Acad Sci U S A. 2017;114(10):E1996-E2005. [2]. Wen W, et al. Discovery and characterization of 2-(cyclopropanesulfonamido)-N-(2-ethoxyphenyl)benzamide, ML382: a potent and selective positive allosteric modulator of MrgX1. ChemMedChem. 2015;10(1):57-61.

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	2.7745 mL	13.8723 mL	27.7446 mL	69.3616 mL
	5 mM	0.5549 mL	2.7745 mL	5.5489 mL	13.8723 mL
	10 mM	0.2774 mL	1.3872 mL	2.7745 mL	6.9362 mL
	15 mM	0.1850 mL	0.9248 mL	1.8496 mL	4.6241 mL
	20 mM	0.1387 mL	0.6936 mL	1.3872 mL	3.4681 mL
	25 mM	0.1110 mL	0.5549 mL	1.1098 mL	2.7745 mL
	30 mM	0.0925 mL	0.4624 mL	0.9248 mL	2.3121 mL
	40 mM	0.0694 mL	0.3468 mL	0.6936 mL	1.7340 mL
	50 mM	0.0555 mL	0.2774 mL	0.5549 mL	1.3872 mL
	60 mM	0.0462 mL	0.2312 mL	0.4624 mL	1.1560 mL
	80 mM	0.0347 mL	0.1734 mL	0.3468 mL	0.8670 mL
	100 mM	0.0277 mL	0.1387 mL	0.2774 mL	0.6936 mL