



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-180**
CAS 号: **863588-32-3**
产品货号: **S89093**

生物活性:

Description	ML-180 (SR1848) 是一种有效的孤儿核受体肝受体同源物 1 (LRH-1; NR5A2) 反向激动剂, IC50 为 3.7 μ M。ML-180 不抑制类固醇生成因子 1 (SF-1; NR5A1; IC50>10 μ M)。ML-180 具有抗依赖 LRH-1 癌症的潜力。	
IC50 & Target	IC50: 3.7 μ M (LRH-1)[1]	
In Vitro	ML-180 (SR1848; 0.01-100 μ M; 48 小时) 在浓度高于 1 μ M 时增殖能力减弱, 并且 EC50 在 Huh-7 细胞中约为 2.8 μ M。ML-180 以 LRH-1 依赖性方式抑制细胞增殖[2]。	
	ML-180 (0.5-5 μ M; 24 小时) 对肝细胞中的细胞周期蛋白-D1 和细胞周期蛋白-E1 表达有显著抑制作用, 但对 SK-OV-3 细胞的抑制作用很小[2]。	
	ML-180 (5 μ M; 24 小时) 导致 LRH-1 表达迅速降低, 并有效抑制内源性 LRH-1 信号传导[2]。	
	ML-180 (0.5-5 μ M; 24 hours) 以剂量依赖的方式抑制 LRH-1 mRNA 的表达[2]。	
	ML-180 (5 μ M; 2 小时) 快速显著降低 Huh-7 和 HepG2 细胞中 LRH-1 受体及其下游靶标 (CYP19、GATA3 和 GATA4) 的 mRNA 水平[2]。	
	Cell Proliferation Assay[2]	
	Cell Line:	Huh-7 cells
	Concentration:	0.01, 0.1, 1, 10, 100 μ M
	Incubation Time:	48 hours
	Result:	Showed diminished capacity to proliferate at concentrations above 1 μ M.
	Cell Cycle Analysis[2]	
	Cell Line:	Huh-7 cells
	Concentration:	0.5, 1, 5 μ M
	Incubation Time:	24 hours
	Result:	Showed a significant inhibition of cyclin-D1 and cyclin-E1 expression in hepatic cells.
	Western Blot Analysis[2]	
	Cell Line:	Huh-7 cells
	Concentration:	5 μ M
	Incubation Time:	24 hours
	Result:	Significantly reduced the LRH-1 protein levels.
In Vivo	RT-PCR[2]	
	Cell Line:	Huh-7 cells
	Concentration:	0.5, 1, 5 μ M
	Incubation Time:	24 hours
	Result:	Inhibited LRH-1 mRNA expression in a dose-dependent manner.
	ML-180 (SR1848; 30 mg/kg; 腹腔注射; 每天; 持续 10 天) 在肾上腺和胰腺组织中显著降低 LRH-1 和 SHP mRNA[2]。	
	Animal Model:	8-week-old C57Bl/6J mice[2]
	Dosage:	30 mg/kg
	Administration:	IP; daily; for 10 days



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

	Result:	Had a statistically significant decrease of both LRH-1 and SHP tissue.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 8.75 mg/mL (22.50 mM); 超声助溶 (<60°C); 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	2.5714 mL	12.8571 mL	25.7142 mL
		5 mM	0.5143 mL	2.5714 mL	5.1428 mL
		10 mM	0.2571 mL	1.2857 mL	2.5714 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 (stored under nitrogen)。-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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 1.19 mg/mL (3.06 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.19 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 11.9 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 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1.19 mg/mL (3.06 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.19 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 11.9 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 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: 50% PEG300 → 50% Saline Solubility: 2 mg/mL (5.14 mM); 悬浊液; 超声助溶。					
参考文献	[1]. Busby S, et al. Discovery of Inverse Agonists for the Liver Receptor Homologue-1 (LRH1; NR5A2). [2]. Corzo CA, et al. Antiproliferation activity of a small molecule repressor of liver receptor homolog 1. Mol Pharmacol. 2015 Feb;87(2):296-304.				



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

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 (stored under nitrogen)。-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	2.5714 mL	12.8571 mL	25.7142 mL	64.2855 mL
	5 mM	0.5143 mL	2.5714 mL	5.1428 mL	12.8571 mL
	10 mM	0.2571 mL	1.2857 mL	2.5714 mL	6.4286 mL
	15 mM	0.1714 mL	0.8571 mL	1.7143 mL	4.2857 mL
	20 mM	0.1286 mL	0.6429 mL	1.2857 mL	3.2143 mL

源叶