



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: **ML193**
CAS 号: **713121-80-3**
产品货号: **S89182**

生物活性:					
Description	ML-193 (CID 1261822) 是一种有效和选择性的 GPR55 拮抗剂, IC50 值为 221 nM。ML-193 对 GPR55 的选择性是 GPR35, CB1 和 CB2 的 27 倍以上。ML-193 可以改善帕金森氏病 (PD) 大鼠的运动和感觉运动缺陷。				
IC50 & Target	IC50: 221 nM (GPR55)[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	U2OS	IC50	0.22 μM	Antagonist activity at HA-epitope tagged GRP55E expressed with GFP-tagged beta-arr2 in human U2OS cells assessed as LPI-stimulated redistribution of beta-arr2 preincubated for 15 mins by beta-arrestin translocation assay	
In Vitro	ML-193 (0.01-100 μM; 预处理 15 分钟) 抑制 L-α-溶血磷脂酰肌醇 (LPI, 10 μM) 和 ML186 (1 μM) 诱导的 β-arrestin 运输, IC50 分别为 0.22 μM 和 0.12 μM[2]。				
	ML-193 (0.01-10 μM; 预处理 30 分钟) 降低 LPI 介导的 ERK1/2 磷酸化, 在 U2OS 细胞中 IC50=0.2 μM[2]。				
	ML-193 (5 μM; 预处理 30 分钟) 减弱 GPR55 激动剂诱导的 hNSCs 增殖率增加[4]。				
	ML-193 (5 μM; 10 天) 减弱 ML184 诱导的 hNSCs 分化增加[4]				
In Vivo	ML193 (1 和 5 μg/大鼠; 纹状体内以 1 μL/分钟的速率) 减轻 PD 大鼠的感觉运动缺陷和滑步, 增加运动协调性[3]。				
	Animal Model:		Male Wistar rats (200-250 g) were induced experimental Parkinson by 6-hydroxydopamine (6-OHDA, 10 μg/rat)[3]		
	Dosage:		1 and 5 μg/rat		
	Administration:		Injected into the right striatum at a rate of 1 μL/min		
	Result:		Increased the time on the rotarod, decreased latency to remove the label and slip steps in 6-OHDA-lesioned rats.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (63.17 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	1.8954 mL	9.4771 mL	18.9541 mL
		5 mM	0.3791 mL	1.8954 mL	3.7908 mL
10 mM		0.1895 mL	0.9477 mL	1.8954 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					



	请您现用现配, 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 (4.74 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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 → 90% Corn Oil Solubility: 2.5 mg/mL (4.74 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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]. Heynen-Genel S, et, al. Screening for Selective Ligands for GPR55-Antagonists. Probe Reports from the NIH Molecular Libraries Program. 2010 Oct 30. [2]. Kotsikorou E, et, al. Identification of the GPR55 antagonist binding site using a novel set of high-potency GPR55 selective ligands. Biochemistry. 2013 Dec 31;52(52):9456-69. [3]. Fatemi I, et, al. The effect of intra-striatal administration of GPR55 agonist (LPI) and antagonist (ML193) on sensorimotor and motor functions in a Parkinson's disease rat model. Acta Neuropsychiatr. 2021 Feb;33(1):15-21. [4]. Hill JD, et, al. Activation of GPR55 increases neural stem cell proliferation and promotes early adult hippocampal neurogenesis. Br J Pharmacol. 2018 Aug;175(16):3407-3421.

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	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积				
	浓度				
DMSO	1 mM	1.8954 mL	9.4771 mL	18.9541 mL	47.3853 mL
	5 mM	0.3791 mL	1.8954 mL	3.7908 mL	9.4771 mL
	10 mM	0.1895 mL	0.9477 mL	1.8954 mL	4.7385 mL
	15 mM	0.1264 mL	0.6318 mL	1.2636 mL	3.1590 mL
	20 mM	0.0948 mL	0.4739 mL	0.9477 mL	2.3693 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

	25 mM	0.0758 mL	0.3791 mL	0.7582 mL	1.8954 mL
	30 mM	0.0632 mL	0.3159 mL	0.6318 mL	1.5795 mL
	40 mM	0.0474 mL	0.2369 mL	0.4739 mL	1.1846 mL
	50 mM	0.0379 mL	0.1895 mL	0.3791 mL	0.9477 mL
	60 mM	0.0316 mL	0.1580 mL	0.3159 mL	0.7898 mL



源叶