



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: **MRGPRX1 agonist 1**

CAS 号: **2377379-39-8**

产品货号: **S89323**

生物活性:

Description	MRGPRX1 agonist 1 是一种高效的 MRGPRX1 激动剂 (EC50=50 nM), 对 δ、μ 和 κ 阿片受体的选择性超过 50 倍。MRGPRX1 agonist 1 对 MRGPC11 无活性。MRGPC11 可抑制高电压激活 (HVA) Ca2+ 电流, 减少神经递质释放, 减轻脊髓伤害性传递。MRGPRX1 agonist 1 可用于慢性疼痛 (尤其是神经性疼痛) 的研究。				
IC50 & Target	EC50: 50 nM (MRGPRX1)[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	EC50	0.05 μM	Agonist activity at human MrgrX1 expressed in HEK293 cells incubated for 2 mins by Fluo4AM dye based FLIPR assay	
In Vitro	MRGPRX1 agonist 1 (compound 16) 是 MRGPRX1 的激动剂。MRGPRX1 agonist 1 对 δ-阿片受体 (Opioid Receptor) 的结合亲和力 (Ki) 为 2.470 μM, 对 μ-阿片受体为 3.730 μM, 对 κ-阿片受体为 12.1 μM[1].				
In Vivo	MRGPRX1 agonist 1 (compound 16) (10 mg/kg; 静脉注射; 单剂量) 在雄性小鼠中表现出对脊髓的良好分布, 脊髓与血浆的 AUC 比值为 6.3, 半衰期约为 0.33 小时, 且在小鼠肝微粒体中代谢迅速 (t1/2<15 min)[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (287.03 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	2.2962 mL	11.4811 mL	22.9621 mL
		5 mM	0.4592 mL	2.2962 mL	4.5924 mL
		10 mM	0.2296 mL	1.1481 mL	2.2962 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.78 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.78 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.78 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Prchalová E, et al. Discovery of Benzamidine- and 1-Aminoisoquinoline-Based Human MAS-Related G-Protein-Coupled Receptor X1 (MRGPRX1) Agonists. J Med Chem. 2019 Sep 26;62(18):8631-8641.

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	2.2962 mL	11.4811 mL	22.9621 mL	57.4053 mL
	5 mM	0.4592 mL	2.2962 mL	4.5924 mL	11.4811 mL
	10 mM	0.2296 mL	1.1481 mL	2.2962 mL	5.7405 mL
	15 mM	0.1531 mL	0.7654 mL	1.5308 mL	3.8270 mL
	20 mM	0.1148 mL	0.5741 mL	1.1481 mL	2.8703 mL
	25 mM	0.0918 mL	0.4592 mL	0.9185 mL	2.2962 mL
	30 mM	0.0765 mL	0.3827 mL	0.7654 mL	1.9135 mL
	40 mM	0.0574 mL	0.2870 mL	0.5741 mL	1.4351 mL
	50 mM	0.0459 mL	0.2296 mL	0.4592 mL	1.1481 mL
	60 mM	0.0383 mL	0.1914 mL	0.3827 mL	0.9568 mL
	80 mM	0.0287 mL	0.1435 mL	0.2870 mL	0.7176 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

	100 mM	0.0230 mL	0.1148 mL	0.2296 mL	0.5741 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶