



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: **ML289**
CAS 号: **1382481-79-9**
产品货号: **T76994**

生物活性:				
Description	ML289 (VU0463597) is a potent, selective, and CNS-penetrant mGlu3 (IC ₅₀ =0.66 μM) negative allosteric modulator. ML289 displays >15-fold selectivity over mGlu2 and is inactive against mGlu5[1]. ML289 is a click chemistry reagent, it contains an Alkyne group and can undergo copper-catalyzed azide-alkyne cycloaddition (CuAAC) with molecules containing Azide groups.			
IC ₅₀ & Target	mGluR3 0.66 μM (IC ₅₀)			
In Vitro	ML289 (VU0463597) is a CNS-penetrant, metabotropic glutamate receptor 3 (mGlu3) negative allosteric modulator probe[1].			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (715.47 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
		1 mM	2.8619 mL	14.3094 mL
		5 mM	0.5724 mL	2.8619 mL
		10 mM	0.2862 mL	1.4309 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 (5.95 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 ddH ₂ O 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 (5.95 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。			



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

	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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (5.95 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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]. Sheffler DJ, et al. Development of a novel, CNS-penetrant, metabotropic glutamate receptor 3 (mGlu3) NAM probe (ML289) derived from a closely related mGlu5 PAM. Bioorg Med Chem Lett. 2012;22(12):3921-3925.

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	2.8619 mL	14.3094 mL	28.6189 mL	71.5471 mL
	5 mM	0.5724 mL	2.8619 mL	5.7238 mL	14.3094 mL
	10 mM	0.2862 mL	1.4309 mL	2.8619 mL	7.1547 mL
	15 mM	0.1908 mL	0.9540 mL	1.9079 mL	4.7698 mL
	20 mM	0.1431 mL	0.7155 mL	1.4309 mL	3.5774 mL
	25 mM	0.1145 mL	0.5724 mL	1.1448 mL	2.8619 mL
	30 mM	0.0954 mL	0.4770 mL	0.9540 mL	2.3849 mL
	40 mM	0.0715 mL	0.3577 mL	0.7155 mL	1.7887 mL
	50 mM	0.0572 mL	0.2862 mL	0.5724 mL	1.4309 mL
	60 mM	0.0477 mL	0.2385 mL	0.4770 mL	1.1925 mL
	80 mM	0.0358 mL	0.1789 mL	0.3577 mL	0.8943 mL
	100 mM	0.0286 mL	0.1431 mL	0.2862 mL	0.7155 mL