



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: **MLS1547**
CAS 号: **315698-36-3**
产品货号: **T77012**

生物活性:

Description	MLS1547 is a highly efficacious G protein-biased dopamine D2 receptor (D2R) agonist (Ki=1.2 μM). MLS1547 stimulates D2R G protein-mediated signaling (EC50=0.37 μM in a calcium mobilization assay). MLS1547 acts as an antagonist for dopamine (DA)-stimulated β-arrestin recruitment to the D2R (IC50=9.9 μM)[1][2].				
In Vitro	MLS1547 fully antagonizes dopamine-mediated β-arrestin recruitment to the D2R in the DiscoveRx assay, with an IC50 of 9.9 μM. Similar results were obtained when MLS1547 was examined for antagonist activity in the D2R β-arrestin BRET assay, demonstrating an IC50 of 3.8 μM. MLS1547 is found to completely displace [3H]methylspiperone binding to the D2R, with a calculated Ki of 1.2 μM[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (93.93 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)				
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	2.8183 mL	14.0913 mL	28.1825 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.5637 mL	2.8183 mL	5.6365 mL
		10 mM	0.2818 mL	1.4091 mL	2.8183 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: ≥ 1.25 mg/mL (3.52 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 12.5 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 ddH2 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: ≥ 1.25 mg/mL (3.52 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。					



	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 12.5 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: $\geq$ 1.25 mg/mL (3.52 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 1.25 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 12.5 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]. Free RB, et al. Discovery and characterization of a G protein-biased agonist that inhibits β-arrestin recruitment to the D2 dopamine receptor. Mol Pharmacol. 2014;86(1):96-105. [2]. Chun LS, et al. Structure-Activity Investigation of a G Protein-Biased Agonist Reveals Molecular Determinants for Biased Signaling of the D2 Dopamine Receptor. Front Synaptic Neurosci. 2018;10:2. Published 2018 Feb 21.

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	2.8183 mL	14.0913 mL	28.1825 mL	70.4563 mL
	5 mM	0.5637 mL	2.8183 mL	5.6365 mL	14.0913 mL
	10 mM	0.2818 mL	1.4091 mL	2.8183 mL	7.0456 mL
	15 mM	0.1879 mL	0.9394 mL	1.8788 mL	4.6971 mL
	20 mM	0.1409 mL	0.7046 mL	1.4091 mL	3.5228 mL
	25 mM	0.1127 mL	0.5637 mL	1.1273 mL	2.8183 mL
	30 mM	0.0939 mL	0.4697 mL	0.9394 mL	2.3485 mL
	40 mM	0.0705 mL	0.3523 mL	0.7046 mL	1.7614 mL
	50 mM	0.0564 mL	0.2818 mL	0.5637 mL	1.4091 mL
	60 mM	0.0470 mL	0.2349 mL	0.4697 mL	1.1743 mL
	80 mM	0.0352 mL	0.1761 mL	0.3523 mL	0.8807 mL