



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: MD2-TLR4-IN-1

CAS 号: 2249801-12-3

产品货号: S87733

生物活性:

Description	MD2-TLR4-IN-1 是一种髓系分化蛋白 2/Toll 样受体 4 (MD2-TLR4) 复合物拮抗剂。MD2-TLR4-IN-1 可抑制 Lipopolysaccharides (HY-D1056) (LPS) 诱导的巨噬细胞中 TNF- α 和 IL-6 的表达, IC50 分别为 0.89 μ M 和 0.53 μ M。MD2-TLR4-IN-1 可用于研究急性肺损伤 (ALI) 。				
IC50 & Target	TLR4				
In Vitro	MD2-TLR4-IN-1 (compound 22m) 通过抑制 RAW264.7 巨噬细胞中的 NF- κ B 发挥其抗炎活性 [1]。 MD2-TLR4-IN-1 直接与 MD2-TLR4 复合物结合, 并破坏 MD2-TLR4 活化[1]。 MD2-TLR4-IN-1 抑制 LPS 诱导的巨噬细胞中 NF- κ B p65 亚基的核水平[1]。 MD2-TLR4-IN-1 与重组 MD2 和 TLR4 蛋白结合, Kd 值分别为 185 μ M 和 146 μ M, 但不与细胞内衔接蛋白 MyD88 相互作用[1]。 MD2-TLR4-IN-1 显著抑制 LPS 激活的小鼠原代巨噬细胞 (MPM) 中 MD2-TLR4 复合物的二聚化[1]。				
In Vivo	MD2-TLR4-IN-1 (5-10 mg/kg; 尾静脉注射; 一次; 在注射 LPS 前 15 分钟) 显著抑制巨噬细胞浸润, 并改善 LPS 攻击小鼠肺组织的组织病理学变化[1]。				
	Animal Model:	Male C57BL/6 mice (18-22 g) injected intraperitoneally with LPS (20 mg/kg)[1].			
	Dosage:	5 mg/kg, 10 mg/kg			
	Administration:	Tail vein injection; once; 15 min before LPS injection			
	Result:	Effectively reduced airspace inflammation and amended the tissue structure of pulmonary lobules. Significantly decreases LPS-induced myeloperoxidase (MPO) activity. Reduced LPS-induced serum TNF-α levels. Decreased the mRNA levels of TNF-α, IL-6, IL-1β, IL-12, and IL-33 in lung tissues. In addition, COX-2 mRNA levels were also reduced.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 83.33 mg/mL (197.80 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	2.3737 mL	11.8686 mL	23.7372 mL
		5 mM	0.4747 mL	2.3737 mL	4.7474 mL
		10 mM	0.2374 mL	1.1869 mL	2.3737 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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 (4.94 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。
参考文献	[1]. Liu Z, et al. Discovery of 3-(Indol-5-yl)-indazole Derivatives as Novel Myeloid Differentiation Protein 2/Toll-like Receptor 4 Antagonists for Treatment of Acute Lung Injury. J Med Chem. 2019 Jun 13;62(11):5453-5469.

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, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时，请在 2 年内使用， -20° C 储存时，请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3737 mL	11.8686 mL	23.7372 mL	59.3430 mL
	5 mM	0.4747 mL	2.3737 mL	4.7474 mL	11.8686 mL
	10 mM	0.2374 mL	1.1869 mL	2.3737 mL	5.9343 mL
	15 mM	0.1582 mL	0.7912 mL	1.5825 mL	3.9562 mL
	20 mM	0.1187 mL	0.5934 mL	1.1869 mL	2.9671 mL
	25 mM	0.0949 mL	0.4747 mL	0.9495 mL	2.3737 mL
	30 mM	0.0791 mL	0.3956 mL	0.7912 mL	1.9781 mL
	40 mM	0.0593 mL	0.2967 mL	0.5934 mL	1.4836 mL
	50 mM	0.0475 mL	0.2374 mL	0.4747 mL	1.1869 mL
	60 mM	0.0396 mL	0.1978 mL	0.3956 mL	0.9890 mL
	80 mM	0.0297 mL	0.1484 mL	0.2967 mL	0.7418 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	0.0237 mL	0.1187 mL	0.2374 mL	0.5934 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶