



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-IN-1
CAS 号: 111797-22-9
产品货号: S88271

生物活性:

Description	MD2-IN-1 是髓样分化蛋白 2 (MD2) 的抑制剂, 对重组人 MD2 (rhMD2) 的 KD 值为 189 μM。				
IC50 & Target	TLR4				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	K562	IC ₅₀	1.1 μM	Antiproliferative activity against human K562 cells after 5 days by MTT assay	
	MCF7	GI ₅₀	3.97 μM	Antiproliferative activity against human MCF7 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 48 hrs by sulforhodamine B assay	
	NCI-H460	GI ₅₀	5.6 μM	Antiproliferative activity against human NCI-H460 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 48 hrs by sulforhodamine B assay	
In Vitro	骨髓分化蛋白 2 (MD2) 是 TLR4 的辅助受体。在这些衍生物中, MD2-IN-1 (化合物 20) 显示出对 LPS 诱导的 TNF-α 和 IL-6 表达的最强抑制作用。与载体相比, 单独的 LPS 大大增加了 TLR4/MD2 复合物的量, 而用 MD2-IN-1 预处理可抑制 TLR4/MD2 复合物增加至载体水平。SPR 分析表明, MD2-IN-1 以剂量依赖性方式与 rhMD2 蛋白结合, KD 值为 189 μM, 而黄腐酚与 MD2 结合的 KD 值为 460 μM。用不同剂量的 MD2-IN-1 进行预处理会剂量依赖性地降低 FITC-LPS 与细胞表面膜中 MD2 的结合, 就平均荧光强度而言, 在 10 μM 时抑制率为 65%。用 MD2-IN-1 预处理还可以剂量依赖性地阻断 MPM 中 LPS 诱导的 MAPK 磷酸化[1]。				
In Vivo	MD2-IN-1 明显降低了 LPS 诱导的 BALF 中蛋白质浓度的增加。LPS 处理组的肺湿/干重比明显高于对照组, MD2-IN-1 处理减少了 LPS 引起的肺水肿。LPS 还会引起可观察到的肺组织病理学变化, 包括炎症浸润、出血、间质水肿、肺泡壁增厚和肺组织破坏等区域。这些组织病理学变化在 MD2-IN-1 处理组中得到改善[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (139.51 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	2.7903 mL	13.9513 mL	27.9026 mL
		5 mM	0.5581 mL	2.7903 mL	5.5805 mL
		10 mM	0.2790 mL	1.3951 mL	2.7903 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					



	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: ≥ 3.25 mg/mL (9.07 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3.25 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 32.5 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 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: 3.25 mg/mL (9.07 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 3.25 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 32.5 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 3.25 mg/mL (9.07 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3.25 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 32.5 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]. Zhang Y, et al. Discovery of new MD2 inhibitor from chalcone derivatives with anti-inflammatory effects in LPS-induced acute lung injury. Sci Rep. 2016 Apr 27;6:25130.

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	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				
DMSO	1 mM	2.7903 mL	13.9513 mL	27.9026 mL	69.7564 mL
	5 mM	0.5581 mL	2.7903 mL	5.5805 mL	13.9513 mL
	10 mM	0.2790 mL	1.3951 mL	2.7903 mL	6.9756 mL
	15 mM	0.1860 mL	0.9301 mL	1.8602 mL	4.6504 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: shyyssw@sina.com

	20 mM	0.1395 mL	0.6976 mL	1.3951 mL	3.4878 mL
	25 mM	0.1116 mL	0.5581 mL	1.1161 mL	2.7903 mL
	30 mM	0.0930 mL	0.4650 mL	0.9301 mL	2.3252 mL
	40 mM	0.0698 mL	0.3488 mL	0.6976 mL	1.7439 mL
	50 mM	0.0558 mL	0.2790 mL	0.5581 mL	1.3951 mL
	60 mM	0.0465 mL	0.2325 mL	0.4650 mL	1.1626 mL
	80 mM	0.0349 mL	0.1744 mL	0.3488 mL	0.8720 mL
	100 mM	0.0279 mL	0.1395 mL	0.2790 mL	0.6976 mL



源叶