



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: TH1020  
CAS 号: 1841460-82-9  
产品货号: S89086

|                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                   |             |             |
|---------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------|-------------|-------------|
| 生物活性:                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                   |             |             |
| Description               | TH1020 是一种有效的选择性的 Toll 样受体 5 (TLR5)/鞭毛蛋白复合拮抗剂, IC <sub>50</sub> 为 0.85 μM。TH1020 抑制鞭毛蛋白诱导的 TLR5 信号传导, 对 TLR2, TLR3, TLR4, TLR7 和 TLR8 无效。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                   |             |             |
| IC <sub>50</sub> & Target | TLR5                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                   |             |             |
| In Vitro                  | <p>TH1020 抑制由 TLR5/鞭毛蛋白复合物的形成介导的下游信号转导。建议 TH1020 与鞭毛蛋白竞争并破坏其与 TLR5 的关联。TH1020 在 0.37 μM 时几乎完全消除 TLR5 介导的 TNF-α 分泌[1]。</p> <p>在细菌菌株 C83901 感染的 IPEC-J2 细胞中, IL-17C 分泌几乎完全被 TH1020 (0.5 μM) 消除[2]。</p> <p>用 TH1020 (0.5 μM) 阻断 TLR5 可显著抑制 C83091 感染的 IPEC-J2 细胞中的猪 β-防御素 (pBD)-2、claudin-1 和 claudin-2 的 mRNA 表达[2]。</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                   |             |             |
| Solvent&Solubility        | <b>细胞实验:</b><br>DMSO 中的溶解度 : 5 mg/mL (11.02 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)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                   |             |             |
|                           | <b>Preparing Stock Solutions</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | <b>Solvent Mass Concentration</b> | <b>1 mg</b> | <b>5 mg</b> |
|                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | 1 mM                              | 2.2049 mL   | 11.0244 mL  |
|                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | 5 mM                              | 0.4410 mL   | 2.2049 mL   |
|                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | 10 mM                             | 0.2205 mL   | 1.1024 mL   |
|                           | <p>*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。</p> <p>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。</p> <p><b>动物实验:</b></p> <p>请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。</p> <p>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:</p> <p>——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;</p> <p>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</p> <p>方案 一</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)</p> <p>Solubility: 0.5 mg/mL (1.10 mM); 悬浊液; 超声助溶</p> <p>此方案可获得 0.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 5.0 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。</p> <p>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。</p> |                                   |             |             |
| 参考文献                      | <p>[1]. Lei Yan, et al. Pyrimidine Triazole Thioether Derivatives as Toll-Like Receptor 5 (TLR5)/Flagellin Complex Inhibitors. ChemMedChem. 2016 Apr 19;11(8):822-6.</p> <p>[2]. Yu Luo, et al. Toll-like Receptor 5-mediated IL-17C Expression in Intestinal Epithelial Cells Enhances Epithelial Host Defense Against F4 + ETEC Infection. Vet Res. 2019 Jun 20;50(1):48.</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                   |             |             |



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

#### 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:  $-80^{\circ}\text{C}$ , 2 years;  $-20^{\circ}\text{C}$ , 1 year.  $-80^{\circ}\text{C}$  储存时,请在 2 年内使用,  $-20^{\circ}\text{C}$  储存时,请在 1 年内使用。

| 可选溶剂 | 质量<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
|      |                  |           |            |            |            |
| DMSO | 1 mM             | 2.2049 mL | 11.0244 mL | 22.0488 mL | 55.1219 mL |
|      | 5 mM             | 0.4410 mL | 2.2049 mL  | 4.4098 mL  | 11.0244 mL |
|      | 10 mM            | 0.2205 mL | 1.1024 mL  | 2.2049 mL  | 5.5122 mL  |



源叶