



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: **SM-102**
CAS 号: **2089251-47-6**
产品货号: **S89314**

生物活性:

Description	SM-102 是一种氨基阳离子脂质, 可用于形成脂质纳米颗粒 (LNP)。SM-102 具有更高的转染效率。SM-102 在脂质纳米颗粒 (LNP) 递送 mRNA 疗法和疫苗的有效性方面发挥着重要作用。
In Vitro	脂质纳米粒子的制备[3][4] 我们在此提供 FDA 批准的 mRNA-1273 (一种 COVID-19 mRNA 疫苗) 中 LNP 的脂质摩尔比。此配方中的脂质摩尔比为 SM-102: DSPC: 胆固醇: DMG-PEG 2000 = 50 : 10 : 38.5 : 1.5[1], RNA 与脂质的重量比为 0.05 (wt/wt)。 A. 脂质混合物的制备 1. 将脂质溶解于乙醇中, 配制成 10 mg/mL 的储备溶液。脂质储备溶液可储存于 -20°C 以备后用。 注 1: 可电离脂质通常是液体。由于其粘度, 应始终称重, 而不是依赖自动移液器的体积。 注意事项 2: 胆固醇溶液需保温 (>37°C) 以保持流动性。应及时转移胆固醇溶液, 避免冷却。 2. 按照说明制备脂质混合物溶液。每毫升脂质混合物添加以下物质: 572 μL 10 mg/mL SM-102、240 μL 10 mg/mL 胆固醇、127 μL 10 mg/mL DSPC 和 61 μL DMG-PEG 2000。充分混合溶液以获得澄清溶液。此混合物含有 10 mg 总脂质。 注 3: 脂质和比例的选择可以根据需要进行改变, 这将影响 LNP 特性 (大小、多分散性和功效) 以及所需的 mRNA 量。 B. mRNA 制备 1. 用 100 mM pH 5 醋酸钠缓冲液制备 166.7 μg/mL mRNA 溶液。 注 4: 脂质: mRNA 重量比影响封装效率。可制备其他重量比作为替代配方, 用户应进行相应调整。 C. 混合 实现溶液快速混合的常用方法有三种: 移液器混合法、涡旋混合法和微流体混合法。所有这些混合方法都可用于各种应用。 值得注意的是, 移液器混合法和涡旋混合法可能会产生更多异质性 LNP, 封装效率较低, 并且容易产生变异。微流体装置能够以高度可控、可重复的方式快速混合, 从而实现均质 LNP 和高封装效率。在这些装置中, 乙醇脂质混合物和水溶液在单独的流中快速混合。当两股流混合时形成 LNP, 然后收集到单个收集管中。 1. 移液器混合法: 1.1. 吸取 3 mL mRNA 溶液, 快速加入 1 mL 脂质混合物溶液中 (一般采用 1:3 的乙醇脂质混合物与水性缓冲液比例)。快速上下移液 20-30 秒。 1.2. 将所得溶液在室温下孵育最多 15 分钟。 1.3. 混合后, 将 LNPs 用 PBS (pH 7.4) 透析 2 小时, 用 0.2 μm 过滤器无菌过滤, 并在 4°C 下储存。 2. 涡旋混合法: 1.1. 在涡旋混合器上以中等速度涡旋 3 mL mRNA 溶液。然后, 快速将 1 mL 脂质混合物溶液加入涡旋溶液中 (通常使用 1:3 的乙醇脂质混合物与水性缓冲液的比例)。继续涡旋所得分散液 20-30 秒。 1.2. 将所得溶液在室温下孵育最多 15 分钟。 1.3. 混合后, 将 LNPs 用 PBS (pH 7.4) 透析 2 小时, 用 0.2 μm 过滤器无菌过滤, 并在 4°C 下储存。



	3. 微流体混合方法: 1.1 将 3 mL mRNA 缓冲液与 1 mL 脂质混合物溶液在微流控装置中以 12 mL/min 的总流速混合(一般采用 1:3 的乙醇脂质混合物与水性缓冲液的比例)。 注 5: 可以改变流量比和总流量等参数来微调 LNP。 1.2. 混合后, 将 LNPs 用 PBS (pH 7.4) 透析 2 小时, 用 0.2 μm 过滤器无菌过滤, 并在 4°C 下储存。																											
Solvent&Solubility	细胞实验: Ethanol 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (140.81 mM) DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (140.81 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) * "≥" means soluble, but saturation unknown <table><tr><th rowspan="4">Preparing Stock Solutions</th><th>Solvent Concentration</th><th>Mass</th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th></tr><tr><th></th><th></th><th></th><th></th><th></th></tr><tr><td>1 mM</td><td></td><td>1.4081 mL</td><td>7.0406 mL</td><td>14.0811 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td></td><td>0.2816 mL</td><td>1.4081 mL</td><td>2.8162 mL</td></tr><tr><td></td><td>10 mM</td><td></td><td>0.1408 mL</td><td>0.7041 mL</td><td>1.4081 mL</td></tr></table> *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: 2.5 mg/mL (3.52 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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: 2.5 mg/mL (3.52 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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。 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	Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg						1 mM		1.4081 mL	7.0406 mL	14.0811 mL	5 mM		0.2816 mL	1.4081 mL	2.8162 mL		10 mM		0.1408 mL	0.7041 mL	1.4081 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration		Mass	1 mg	5 mg	10 mg																						
	1 mM			1.4081 mL	7.0406 mL	14.0811 mL																						
	5 mM		0.2816 mL	1.4081 mL	2.8162 mL																							
	10 mM		0.1408 mL	0.7041 mL	1.4081 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

	请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.52 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Escalona-Ray O, et al. In vitro and in vivo evaluation of clinically-approved ionizable cationic lipids shows divergent results between mRNA transfection and vaccine efficacy. Biomed Pharmacother. 2023 Sep;165:115065. [2]. Cho HY, et al. Effective Perturbations on the Amplitude and Hysteresis of Erg-Mediated Potassium Current Caused by 1-Octylnonyl 8-[(2-hydroxyethyl)[6-oxo-6(undecyloxy)hexyl]amino]-octanoate (SM-102), a Cationic Lipid. Biomedicines. 2021 Oct 1;9(10):1367. [3]. Mashima R, et al. Lipid Nanoparticles: A Novel Gene Delivery Technique for Clinical Application. Curr Issues Mol Biol. 2022 Oct 19;44(10):5013-5027. [4]. McKenzie RE, et al. mRNA Synthesis and Encapsulation in Ionizable Lipid Nanoparticles. Curr Protoc. 2023 Sep;3(9):e898.

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
Ethanol / DMSO	1 mM	1.4081 mL	7.0406 mL	14.0811 mL	35.2028 mL
	5 mM	0.2816 mL	1.4081 mL	2.8162 mL	7.0406 mL
	10 mM	0.1408 mL	0.7041 mL	1.4081 mL	3.5203 mL
	15 mM	0.0939 mL	0.4694 mL	0.9387 mL	2.3469 mL
	20 mM	0.0704 mL	0.3520 mL	0.7041 mL	1.7601 mL
	25 mM	0.0563 mL	0.2816 mL	0.5632 mL	1.4081 mL
	30 mM	0.0469 mL	0.2347 mL	0.4694 mL	1.1734 mL
	40 mM	0.0352 mL	0.1760 mL	0.3520 mL	0.8801 mL
	50 mM	0.0282 mL	0.1408 mL	0.2816 mL	0.7041 mL
	60 mM	0.0235 mL	0.1173 mL	0.2347 mL	0.5867 mL
	80 mM	0.0176 mL	0.0880 mL	0.1760 mL	0.4400 mL
	100 mM	0.0141 mL	0.0704 mL	0.1408 mL	0.3520 mL