



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: **MF-766**
CAS 号: **1050656-06-8**
产品货号: **S89381**

生物活性:

Description	MF-766 是一种高效、选择性和口服活性的 EP4 拮抗剂, Ki 值为 0.23 nM。MF-766 在功能检测中表现为一种完整的拮抗剂, 其 IC50 为 1.4 nM (在 10% HS 存在时变成 1.8 nM)。MF-766 可用于癌症和炎症疾病研究。				
IC50 & Target[1]	EP4 0.23 nM (Ki)				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	IC50	1.3 nM	Antagonist activity at human prostanoid EP4 receptor expressed in HEK293 cells assessed as inhibition of PGE2-induced cAMP accumulation by scintillation proximity assay	
	HEK293	IC50	1.8 nM	Antagonist activity at human prostanoid EP4 receptor expressed in HEK293 cells assessed as inhibition of PGE2-induced cAMP accumulation by scintillation proximity assay in presence of 10% human serum	
In Vitro	MF-766 (0.01-10 μM; 预处理 1 小时, 然后用 50 ng/mL IL-2 刺激; 有和没有 0.33 μM PGE2; 18 小时) 逆转人 NK 细胞中 PGE2 抑制的 IFN-γ 分泌。此外, NK 细胞活力不受 MF-766 的影响 [2]。				
In Vivo	MF-766 (口服强饲法; 30 mg/kg; 每天一次; 21 天) 在 CT26 肿瘤模型中表现出 49% 的肿瘤抑制率。但它在 EMT6 和 4T1 肿瘤模型中没有表现出显著差异[2]。				
	MF-766 (口服灌胃; 30 mg/kg 联合抗 PD-1 mDX400; 每天一次; 21 天; q4dx8) 在不同的临床前模型中显示出有效的抗肿瘤活性。CT26 肿瘤、EMT6 肿瘤和 4T1 肿瘤模型中肿瘤抑制率的百分比分别为 89%、66% 和 40%[2]。				
	Animal Model:		Female C57BL/6 J strain mice injected subcutaneously with CT26, EMT6, or 4T1 cells[2]		
	Dosage:		30 mg/kg combination with anti-PD-1 mDX400		
	Administration:		Oral gavage; 10 mg/kg or 30 mg/kg combination with anti-PD-1 mDX400; once daily; 21 days; q4dx8		
	Result:		Improved anti-tumor activity in the setting of PD-1 blockade in multiple syngeneic models.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (104.50 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	2.0900 mL	10.4502 mL	20.9004 mL
		5 mM	0.4180 mL	2.0900 mL	4.1801 mL
		10 mM	0.2090 mL	1.0450 mL	2.0900 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.23 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]. John Colucci, et al. Discovery of 4-[1-[[4-(trifluoromethyl)benzyl]-1H-indol-7-yl] carbonyl]amino]cyclopropyl]benzoic acid (MF-766), a highly potent and selective EP4 antagonist for treating inflammatory pain. Bioorg Med Chem Lett [2]. Yun Wang, et al. Combination of EP 4 antagonist MF-766 and anti-PD-1 promotes anti-tumor efficacy by modulating both.

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	2.0900 mL	10.4502 mL	20.9004 mL	52.2510 mL
	5 mM	0.4180 mL	2.0900 mL	4.1801 mL	10.4502 mL
	10 mM	0.2090 mL	1.0450 mL	2.0900 mL	5.2251 mL
	15 mM	0.1393 mL	0.6967 mL	1.3934 mL	3.4834 mL
	20 mM	0.1045 mL	0.5225 mL	1.0450 mL	2.6125 mL
	25 mM	0.0836 mL	0.4180 mL	0.8360 mL	2.0900 mL
	30 mM	0.0697 mL	0.3483 mL	0.6967 mL	1.7417 mL
	40 mM	0.0523 mL	0.2613 mL	0.5225 mL	1.3063 mL
	50 mM	0.0418 mL	0.2090 mL	0.4180 mL	1.0450 mL
	60 mM	0.0348 mL	0.1742 mL	0.3483 mL	0.8708 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

	80 mM	0.0261 mL	0.1306 mL	0.2613 mL	0.6531 mL
	100 mM	0.0209 mL	0.1045 mL	0.2090 mL	0.5225 mL



源叶