

JTE 013 ; JTE-013

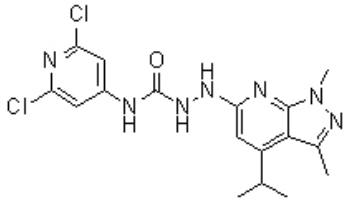
产品编号 : MB3757

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : powder

基本信息

分子式	C17H19Cl2N7O	结 构 式	
分子量	408.29		
CAS No.	383150-41-2		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 81 mg/mL (198.38 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 34 mg/mL (83.27 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介 : JTE-013 是选择性 sphingosine 1- (S1P)受体拮抗剂。

别名 :

1-[1,3-Dimethyl-4-(2-methylethyl)-1H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-6-yl]-4-(2,6-dichloro-4-pyridinyl)-s
emicarbazide

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色粉末

溶解性 :DMSO : 81 mg/mL (198.38 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 34 mg/mL (83.27
mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	JTE-013 是 sphingosine 1-phosphate receptor 2(S1P2)拮抗剂 (IC50=17.6 nM)。在超过 10 μM 的浓度下, 对 S1P1 或 S1P3 没有作用。在 HTC4 细胞中, JTE-013 拮抗 S1P4 的 Ki 值为 237 nM。
靶点	S1PR2(human) (in CHO cells) 17 nM S1PR2(rat) (in CHO cells) 22 nM
体外研究	JTE-013 能逆转 S1P2 信号通路对血管 ECs 和平滑肌细胞的细胞迁移的抑制作用。它能够在体外调节内皮细胞紧密连接和屏障功能。JTE-013 抑制 S1P2 信号通路, 显著地增强了 S1P 增加 TEER (体外内皮完整性的检测指标) 的作用, 增强衰老 ECs 中 TJs 的形成。
体内研究	JTE-013 对 S1P2 的抑制在体内动物细胞中显著地抑制了微血管通透性。它能够在中风的实验动物模型中, 通过抑制脑血管通透性、脑内出血的发展、神经血管损伤, 调节大脑内皮层的反应。JTE-013 在体内、体外模型中减少肥大细胞的激活、气道浸润和血清中组胺和几种细胞因子的含量。在小鼠模型中, JTE-013 抑制 streptozotocin 诱导的血糖升高、胰岛 B 细胞凋亡以及糖尿病的发生。在

新西兰肥胖糖尿病小鼠模型中,在高脂饮食的条件下,JTE-013 能够保护胰岛 B 细胞。对 ApoE-/- 小鼠处理以 JTE-013 能够降低 IL-1b 和 IL-18 的血浆浓度,S1P2 基因缺陷可减少动脉粥样硬化。JTE-013 为治疗炎症疾病如动脉粥样硬化和败血症提供了新方法。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3824	PF-543
MB3825	BAF312 (Siponimod)
MB3755	SKI II
MB3756	Ponesimod(ACT-128800)

用途及描述: 科研试剂,广泛应用于分子生物学,药理学等科研方面,严禁用于人体。JTE-013 是选择性 sphingosine 1- (S1P)受体拮抗剂。JTE-013 对 S1P2 (EDG-5)具有高度选择性。抑制 S1P 与人 S1P2 受体结合,不拮抗 S1P1。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4492 mL	12.2462 mL	24.4924 mL
5 mM	0.4898 mL	2.4492 mL	4.8985 mL
10 mM	0.2449 mL	1.2246 mL	2.4492 mL
50 mM	0.0490 mL	0.2449 mL	0.4898 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: 人脐静脉内皮细胞(HUVECs) Concentrations: 0.01, 0.1, 1 μM Incubation Time: 10 min Method: 用不同浓度的 JTE-013 对 HUVECs 进行预处理 处理 10 分钟 然后让 HUVECs 向下层小室迁移 4 h (下层小室中具有特定浓度的 Sph-1-P)。收集、固定迁移过来的、在滤网下层的细胞, 并进行染色和计数。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 小鼠(C57BL/6×129Sv 遗传背景) Formulation: -- Dosages: 1.2 mg/kg Administration: 腹腔注射</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装,若用于细胞培养,请提前做预处理,除去热原细菌,否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息,我司不保证所提供信息的权威性,以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装: 您收到货物后最好不要自己进行分包,因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质;如您有特殊包装要求,请在订购时候与我们客服代表阐明,当然价格会做适当调整。对于开盖后,长期未使用的,请务必重新密封好,建议 Parafilm 封口膜,并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长,超过产品有效期,建议您重新购买,以免影响实验质量。

2 储备液制备: 大部分试剂的溶液形式稳定性较差,请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液,请选择合适溶剂 细胞培养类多选择 DMSO 储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存,一般可以稳定存在 3-6

个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。