



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

产品名称: **JTE-013**
CAS 号: **383150-41-2**
产品货号: **S89187**

生物活性:

Description	JTE-013 是一种有效且选择性的 S1P2 (鞘氨醇 1-磷酸 2) 拮抗剂。JTE-013 抑制放射性标记的 S1P 与人和大鼠 S1P2 的特异性结合, IC50 分别为 17 nM 和 22 nM。			
IC50 & Target	IC50: 17 nM (S1P2 for human) and 22 nM (S1P2 for rat)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	Caco-2	CC ₅₀	16.45 μM	Toxicity against Caco-2 cells determined at 48 hours by intracellular ATP concentration using the CellTiter-Glo Luminescent Cell Viability Assay
	Caco-2	IC ₅₀	5.97 μM	Determination of IC50 values for inhibition of SARS-CoV-2 induced cytotoxicity of Caco-2 cells after 48 hours by high content imaging
	HCT-116	EC ₅₀	17.13 μM	Reversal of 5-FU resistance against human HCT-116 cells overexpressing DPD assessed as inhibition of cell proliferation measured after 72 hrs in presence of 5-FU by MTT assay
	HCT-116	EC ₅₀	18.28 μM	Reversal of 5-FU resistance against 5-FU resistant DPD expressed human HCT-116 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 48 hrs in presence of 5-FU by MTT assay
	NCM460	EC ₅₀	61.34 μM	Cytotoxicity against human NCM460 cells assessed as cell viability measured after 72 hrs in presence of 5-FU by MTT assay
	SW620/5-FU	EC ₅₀	58.58 μM	Reversal of 5-FU resistance against human SW620/5-FU cells assessed as inhibition of cell proliferation measured after 72 hrs in presence of 5-FU by MTT assay
	SW620/5-FU	EC ₅₀	58.58 μM	Reversal of 5-FU resistance against human SW620/5-FU cells assessed as reduction in cell viability incubated for 48 hrs in presence of 5-FU by MTT assay
	In Vitro	JTE-013 (50-200 μM; 1-3 天) 可降低细胞活力[1]。		
JTE-013 (10-1000 nM; 30 分钟) 可逆转 S1P 诱导的 Akt 抑制并抑制 S1P 诱导的 ERK 活化 [1]。				
JTE-013 对 S1P3 的抑制率为 4.2%, 并且在浓度高达 10 μM 时不会拮抗 S1P1[1]。				
Cell Viability Assay[1]				
Cell Line:		SK-N-AS cells		
Concentration:		50, 100, 150, 200 μM		
Incubation Time:		1-3 days		
Result:		Reduced cell viability.		
Western Blot Analysis[1]				
Cell Line:	SK-N-AS cells			
Concentration:	10, 100, 1000 nM			



	Incubation Time:	30 mins			
	Result:	Reversed S1P-induced Akt inhibition and inhibited S1P-induced ERK activation.			
In Vivo	JTE-013 (灌胃; 连续 14 天, 每天 30 mg/kg) 可减小肿瘤大小和肿瘤重量[1]。				
	Animal Model:	Six-week-old female athymic NCr-nu/nu nude mice[1]			
	Dosage:	30 mg/kg			
	Administration:	Gavage; daily for 14 consecutive days			
	Result:	Reduced tumor size and tumor weight.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (244.92 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	2.4492 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
	*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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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 (6.12 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。					
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 ddH ₂ 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% Corn Oil					
Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.12 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。					



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

参考文献

[1]. Li MH, et al. Antitumor Activity of a Novel Sphingosine-1-Phosphate 2 Antagonist, AB1, in Neuroblastoma. J Pharmacol Exp Ther. 2015 Sep;354(3):261-8.

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, 1 year; -20° C, 6 months。 -80° C 储存时,请在 1 年内使用, -20° C 储存时,请在 6 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	2.4492 mL	12.2462 mL	24.4924 mL	61.2310 mL
	5 mM	0.4898 mL	2.4492 mL	4.8985 mL	12.2462 mL
	10 mM	0.2449 mL	1.2246 mL	2.4492 mL	6.1231 mL
	15 mM	0.1633 mL	0.8164 mL	1.6328 mL	4.0821 mL
	20 mM	0.1225 mL	0.6123 mL	1.2246 mL	3.0615 mL
	25 mM	0.0980 mL	0.4898 mL	0.9797 mL	2.4492 mL
	30 mM	0.0816 mL	0.4082 mL	0.8164 mL	2.0410 mL
	40 mM	0.0612 mL	0.3062 mL	0.6123 mL	1.5308 mL
	50 mM	0.0490 mL	0.2449 mL	0.4898 mL	1.2246 mL
	60 mM	0.0408 mL	0.2041 mL	0.4082 mL	1.0205 mL
	80 mM	0.0306 mL	0.1531 mL	0.3062 mL	0.7654 mL
	100 mM	0.0245 mL	0.1225 mL	0.2449 mL	0.6123 mL