



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: JR14a
CAS 号: 2411440-41-8
产品货号: S89357

生物活性:					
Description	JR14a 是一种有效的人补体 C3a 受体噤吩拮抗剂。JR14a 对人 C3a 受体的选择性高于 C5a 受体。JR14a 可以抑制 C3aR 介导的炎症。				
IC50 & Target	human complement C3a receptor[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	LAD2	IC ₅₀	8 nM	Antagonist at C3a receptor in human LAD2 cells assessed as inhibition of C3a-induced beta-hexosaminidase release preincubated for 30 mins followed by C3a addition	
In Vitro	JR14a (0.1 nM-100 μM) 抑制人单核细胞来源的巨噬细胞中 C3a 诱导的细胞内 Ca2+ 释放, IC50 为 10 nM[1]。				
	JR14a (0.1 nM-100 μM) 暴露于大鼠肝微粒体超过 1 小时[1]。				
In Vivo	JR14a (0.1 nM- 100 μM) 抑制人 LAD2 肥大细胞中 C3a 诱导的 β-hexosaminidase 分泌, IC50 为 8 nM[1]。				
	JR14a (10 mg/kg; p.o. 2 h prior) 在炎症和水肿的急性大鼠爪模型中注射激动剂后 30 分钟, 爪肿胀比对照减少 65%[1]。				
	JR14a (1 mg/kg; iv) 在大鼠中表现出消除半衰期 (191 分钟)、清除率 (4.4 mL/min/kg) 和 AUC (3795 ng h/mL)[1]。				
	JR14a (10 mg/kg; po) 在大鼠中表现出 Cmax (88 ng/mL)、Tmax (300 min) 和 AUC (478 ng h/mL)[1]。				
	Animal Model:	Male Wister rats (8 weeks, 250-300 g) were injected with BR103[1]			
	Dosage:	10 mg/kg			
	Administration:	P.o. 2 h prior to agonist challenge			
	Result:	Inhibited C3aR-mediated inflammation.			
	Animal Model:	Male Wister rats (8 weeks, 250-300 g)[1]			
	Dosage:	1 mg/kg for i.v.; 10 mg/kg for oral (Pharmacokinetic Analysis)			
Administration:	Intravenous administration and oral administration				
Result:	I.v.: t _{1/2} =191 min, clearance=4.4 mL/min/kg, AUC=3795 ng•h/mL.				
	P.o.: C _{max} =88 ng/mL, T _{max} =300 min, AUC=478 ng•h/mL.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (93.73 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.8745 mL	9.3726 mL	18.7452 mL
		5 mM	0.3749 mL	1.8745 mL	3.7490 mL
10 mM		0.1875 mL	0.9373 mL	1.8745 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, 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。					



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: shyyysw@sina.com

	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 (4.69 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 ddH₂O 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 (4.69 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 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 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: 2.5 mg/mL (4.69 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 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: 50% PEG300 → 50% Saline Solubility: 5 mg/mL (9.37 mM); 悬浊液; 超声助溶。
参考文献	[1]. Rowley JA, et, al. Potent Thiophene Antagonists of Human Complement C3a Receptor with Anti-Inflammatory Activity. J Med Chem. 2020 Jan 23;63(2):529-541.
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, 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。	



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.8745 mL	9.3726 mL	18.7452 mL	46.8630 mL
	5 mM	0.3749 mL	1.8745 mL	3.7490 mL	9.3726 mL
	10 mM	0.1875 mL	0.9373 mL	1.8745 mL	4.6863 mL
	15 mM	0.1250 mL	0.6248 mL	1.2497 mL	3.1242 mL
	20 mM	0.0937 mL	0.4686 mL	0.9373 mL	2.3431 mL
	25 mM	0.0750 mL	0.3749 mL	0.7498 mL	1.8745 mL
	30 mM	0.0625 mL	0.3124 mL	0.6248 mL	1.5621 mL
	40 mM	0.0469 mL	0.2343 mL	0.4686 mL	1.1716 mL
	50 mM	0.0375 mL	0.1875 mL	0.3749 mL	0.9373 mL
	60 mM	0.0312 mL	0.1562 mL	0.3124 mL	0.7810 mL
	80 mM	0.0234 mL	0.1172 mL	0.2343 mL	0.5858 mL

源叶