

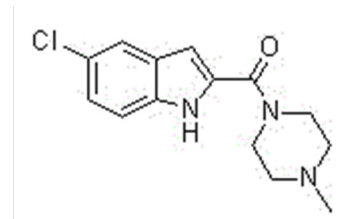
JNJ-7777120 (Histamine Receptor拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD9549-10mM	JNJ-7777120 (Histamine Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD9549-5mg	JNJ-7777120 (Histamine Receptor拮抗剂)	5mg
SD9549-25mg	JNJ-7777120 (Histamine Receptor拮抗剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(5-chloro-1H-indol-2-yl)-(4-methylpiperazin-1-yl)methanone
简称	JNJ-7777120
别名	JNJ 7777120, JNJ7777120
中文名	N/A
化学式	C ₁₄ H ₁₆ ClN ₃ O
分子量	277.75
CAS号	459168-41-3
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 56mg/ml; Ethanol 8mg/ml
溶液配制	5mg加入1.80ml DMSO, 或每2.78mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD9549-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	JNJ-7777120是第一个, 有效的, 选择性非咪唑histamine H4 receptor拮抗剂, Ki为4.5nM, 比作用于其他组胺受体选择性高1000倍以上。				
信号通路	Neuronal Signaling; GPCR & G Protein				
靶点	Histamine H4 receptor	—	—	—	—
IC50	4.5nM(Ki)	—	—	—	—
体外研究	JNJ 7777120高亲和力结合到H4受体, 比作用于其他组胺受体选择性高1000多倍。JNJ 7777120是有效的, 选择性H4受体拮抗剂, 对50多种其他靶点没有或几乎没有亲和力。				
体内研究	JNJ 7777120具有口服生物利用度, 处理大鼠为30%, 处理犬为100%, 处理这两个品种的半衰期都为3小时。JNJ 7777120处理小鼠骨髓衍生的肥大细胞, 抑制组胺诱导的趋化性和钙流入。JNJ 7777120处理小鼠, 抑制组胺诱导的气管肥大细胞从结缔组织向上皮细胞的迁移。JNJ 7777120处理小鼠酵母聚糖诱导的腹膜炎模型, 显著抑制中性粒细胞浸润。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	使用从转染人, 大鼠, 或小鼠H4受体, 人H3受体, 或H1受体的SK-N-MC细胞中获得的细胞颗粒。进行小鼠H1受体结合, 使用新鲜的小鼠脑。细胞颗粒或小鼠脑在含5mM EDTA的50mM Tris pH 7.5中匀浆化, 从800g转速涡旋中收集上清液, 在30000g转速下再离心30分钟。细胞颗粒在含5mM EDTA的50mM Tris pH 7.5中再匀浆化。H4竞争性结合研究中, 在有或无JNJ 7777120时, 人、小鼠和大鼠细胞膜与10、40和150nM [³ H]组胺(特异活性为23Ci/mmol), 在25°C下分别温育45分钟。使用100μM未标记的组胺限定非特异性结合。测定作用于人、小鼠和大鼠H4受体的Kd值分别为5、42和178nM, Bmax值分别为1.12、1.7和0.68pmol/mg 蛋白。相似地, 用于H3受体结合实验的配体为[³ H]N-α-甲基组胺(特异活性为82Ci/mmol), 使用100μM未标记的组胺限定非特异性结合。测定作用于人和大鼠H3受体的Kd值分别为1和0.8nM, Bmax值分别为2.13和0.4pmol/mg 蛋白。用于人和小鼠H1受体结合实验的配体为[³ H]Pyrilamine(特异活性为20 Ci/mmol), 使用10μM未标记的Diphenhydramine限定非特异性结合。测定作用于人和小鼠H3受体的Kd值分别为1和3nM, Bmax值分别为2.68和0.2pmol/mg蛋白。测定与豚鼠H1和

	H2受体的结合。进行H1受体结合实验，使用豚鼠小脑。放射性配体为 ³ H]Pyrilamine, 100μM Triprolidine用于测定非特异性结合。进行H2受体结合实验，使用豚鼠纹状体。放射性配体为 ³ H]天门冬氨酸氨基转移酶, 100μM Tiotidine用于测定非特异性结合。按以上方法使用浓度不断增加的 ³ H]JNJ 7777120代替 ³ H]组胺, 在有100μM未标记的组胺存在时, 测定 ³ H]JNJ 7777120(特异活性为84Ci/mmol)作用于人和小鼠H4受体的Kd值。所有研究中, 根据实验测定的合适的Kd值计算Ki值。
--	--

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	雌性BALB/c小鼠
配制	5% (w/v)葡萄糖, 溶于水
剂量	200mg/kg
给药方式	口服处理

➤ 参考文献:

- 1.Jablonowski JA, et al. J Med Chem, 2003, 46(19), 3957-3960.
- 2.Thurmond RL, et al. J Pharmacol Exp Ther, 2004, 309(1), 404-413.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD9549-10mM	JNJ-7777120 (Histamine Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD9549-5mg	JNJ-7777120 (Histamine Receptor拮抗剂)	5mg
SD9549-25mg	JNJ-7777120 (Histamine Receptor拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性, 操作时请小心, 并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01