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：JNJ-7777120
CAS 号：459168-41-3
产品货号：S27096

生物活性：

Description	JNJ-7777120 是一种强效的和具有选择性的 组胺 H4 受体 拮抗剂 (Ki=4.5 nM)。JNJ-7777120 能有效阻断组胺诱导的小鼠气管肥大细胞从结缔组织向上皮细胞的迁移。JNJ-7777120 还能在小鼠 Zymosan 诱导的腹膜炎模型中显著阻断中性粒细胞的浸润。JNJ-7777120 具有研究抗瘙痒和抗炎的较好潜力.
IC50 & Target	H4 receptor
In Vitro	JNJ-7777120 (0、10、100、1000 nM；~6 小时) 在 SK-N-MC 细胞中显示人和小鼠组胺 H4 受体的功能性拮抗作用[1]。 JNJ-7777120 (10 μM；10 分钟) 阻断小鼠骨髓来源的肥大细胞中组胺诱导的趋化性和钙内流[1]。 JNJ7777120 (30-100 μM；30 分钟) 剂量依赖性地抑制抗原刺激的 BMMC 中胸腺和活化调节趋化因子/CCL17 和巨噬细胞衍生趋化因子 CCL22 的产生[2].

Cell Viability Assay[1]

Cell Line:	SK-N-MC cells (expressing the human or mouse histamine H4 receptor)
Concentration:	0, 10, 100, 1000 nM
Incubation Time:	~6 h
Result:	Exhibited antagonistic effect on human and mouse histamine H4 receptors.

Immunofluorescence[1]

Cell Line:	Mouse mast cells
Concentration:	10 μM
Incubation Time:	10 min
Result:	Exhibited a very potent antagonistic effect on the H4 receptor in primary cells.

Cell Viability Assay[1]

Cell Line:	BMMC
Concentration:	30-100 μM
Incubation Time:	30 min
Result:	Significantly inhibited the production of TARC (thymus and activation-regulated chemokine) and MDC (macrophage-derived chemokine).

In Vivo

JNJ-7777120 显示出对人类、小鼠和大鼠受体的等效作用，并且比 H1、H2 或 H3 受体，表现出至少 1000 倍的选择性[1]。

JNJ-7777120 在大鼠中的口服生物利用度约为 30%，在狗中为 100%，在两个物种的半衰期均为 3 小时[1]。

JNJ-7777120 (20 mg/kg；sc；每天单次，持续 2 天) 阻断组胺诱导的气管肥大细胞从结缔组织向上皮细胞的迁移小鼠[1]。

JNJ-7777120 (10 mg/kg；sc；单次) 显著阻断小鼠酵母聚糖诱导的腹膜炎模型中的中性粒细胞浸润[1]。

Animal Model:	BALB/c mice[1].
Dosage:	20 mg/kg

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

Administration:	Subcutaneous injection; single daily for 2 days
Result:	Blocked histamine induced an increase in the number of mast cells per tracheal section and a significant migration of mast cells towards the tracheal epithelium.
Animal Model:	Male outbred Swiss albino mice (zymosan-induced peritonitis model)[1].
Dosage:	10 mg/kg
Administration:	Subcutaneous injection; single
Result:	Led to a statistically significant reduction of neutrophil infiltration.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ： ≥ 50 mg/mL (180.02 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响，请使用新开封的 DMSO)

* "≥" means soluble, but saturation unknown

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	3.6004 mL	18.0018 mL	36.0036 mL
	5 mM	0.7201 mL	3.6004 mL	7.2007 mL
	10 mM	0.3600 mL	1.8002 mL	3.6004 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。

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 (9.00 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_2O 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 (9.00 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

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

	-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 (9.00 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]. Thurmond RL, et al. A potent and selective histamine H4 receptor antagonist with anti-inflammatory properties. J Pharmacol Exp Ther. 2004 Apr;309(1):404-13. [2]. Ohsawa Y, et al. The antagonism of histamine H1 and H4 receptors ameliorates chronic allergic dermatitis via anti-pruritic and anti-inflammatory effects in NC/Nga mice. Allergy. 2012 Aug;67(8):1014-22.

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。

可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	**1 mM**	3.6004 mL	18.0018 mL	36.0036 mL	90.0090 mL
	5 mM	0.7201 mL	3.6004 mL	7.2007 mL	18.0018 mL
	10 mM	0.3600 mL	1.8002 mL	3.6004 mL	9.0009 mL
	15 mM	0.2400 mL	1.2001 mL	2.4002 mL	6.0006 mL
	20 mM	0.1800 mL	0.9001 mL	1.8002 mL	4.5005 mL
	25 mM	0.1440 mL	0.7201 mL	1.4401 mL	3.6004 mL
	30 mM	0.1200 mL	0.6001 mL	1.2001 mL	3.0003 mL
	40 mM	0.0900 mL	0.4500 mL	0.9001 mL	2.2502 mL
	50 mM	0.0720 mL	0.3600 mL	0.7201 mL	1.8002 mL
	60 mM	0.0600 mL	0.3000 mL	0.6001 mL	1.5002 mL
	80 mM	0.0450 mL	0.2250 mL	0.4500 mL	1.1251 mL
	100 mM	0.0360 mL	0.1800 mL	0.3600 mL	0.9001 mL