



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 63533054

CAS 号: 1802326-66-4

产品货号: S88501

生物活性:

Description	JNJ-63533054 是一种有效的, 选择性的, 具有口服活性的 GPR139 激动剂, 对人 GPR139 的 EC50 为 16 nM。JNJ-63533054 对 GPR139 的选择性高于其他 GPCR, 离子通道和转运蛋白。JNJ-63533054 可以穿过血脑屏障 (BBB)。					
IC50 & Target	EC50: 16 nM (Human GPR139), 63 nM (Rat GPR139) and 28 nM (Mouse GPR139)[1]					
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description		
	HEK293	EC50	16 nM	Agonist activity at human GPR139 receptor expressed in HEK293 cells assessed as calcium mobilization by FLIPR assay		
In Vitro	JNJ-63533054 在钙动员 (EC50 为 16 nM) 和 GTP γ S 结合 (EC50 为 17 nM) 测定中特异性激活人 GPR139。JNJ-63533054 还以相似的效力激活大鼠和小鼠 GPR139 受体 (大鼠 EC50 为 63 nM, 小鼠 EC50 为 28 nM)[1]。					
	在人类 GPR139 的饱和研究中, 观察到[3H] JNJ-63533054 的单个高亲和力和结合位点群 (Kd 为 10 nM)。Bmax 值为 26 pmol/mg 蛋白质。大鼠 GPR139 和小鼠 GPR139 的饱和度研究产生了相同范围内的 Kd 值 (分别为 32 nM 和 23 nM; Bmax=8.5 pmol/mg 蛋白质和 6.2 pmol/mg 蛋白质)[1]。					
In Vivo	JNJ-63533054 (3-30 mg/kg; 口服给药; 一次; SD 大鼠) 处理在第一个小时内诱导剂量依赖性运动活动减少[1]。					
	药代动力学在大鼠中检测了 JNJ-63533054 (化合物 7c; 1 mg/kg 静脉注射; 5 mg/kg po)。IV 清除率为 53 mL/min/kg, Cmax 为 317 ng/mL (~1 μ M), t1/2 为 2.5 小时, JNJ-63533054 穿过血脑屏障 (BBB)的 脑血浆比 (b/p) 为 1.2 [2]。					
	Animal Model:		Male Sprague-Dawley rats (350-450 g)[1]			
	Dosage:		3 mg/kg, 10 mg/kg, and 30 mg/kg			
	Administration:		Oral administration; once			
Solvent&Solubility	Result:		Induced a dose-dependent reduction in locomotor activity in the first hour.			
	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 50 mg/mL (157.84 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 Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM		3.1568 mL	15.7838 mL	31.5676 mL
5 mM			0.6314 mL	3.1568 mL	6.3135 mL	
10 mM			0.3157 mL	1.5784 mL	3.1568 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 (7.89 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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.89 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]. Liu C, et al. GPR139, an Orphan Receptor Highly Enriched in the Habenula and Septum, Is Activated by the Essential Amino Acids L-Tryptophan and L-Phenylalanine. Mol Pharmacol. 2015 Nov;88(5):911-25. [2]. Dvorak CA, et al. Identification and SAR of Glycine Benzamides as Potent Agonists for the GPR139 Receptor. ACS Med Chem Lett. 2015 Jul 20;6(9):1015-8.

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, 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	3.1568 mL	15.7838 mL	31.5676 mL	78.9191 mL
	5 mM	0.6314 mL	3.1568 mL	6.3135 mL	15.7838 mL
	10 mM	0.3157 mL	1.5784 mL	3.1568 mL	7.8919 mL
	15 mM	0.2105 mL	1.0523 mL	2.1045 mL	5.2613 mL
	20 mM	0.1578 mL	0.7892 mL	1.5784 mL	3.9460 mL
	25 mM	0.1263 mL	0.6314 mL	1.2627 mL	3.1568 mL



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

	30 mM	0.1052 mL	0.5261 mL	1.0523 mL	2.6306 mL
	40 mM	0.0789 mL	0.3946 mL	0.7892 mL	1.9730 mL
	50 mM	0.0631 mL	0.3157 mL	0.6314 mL	1.5784 mL
	60 mM	0.0526 mL	0.2631 mL	0.5261 mL	1.3153 mL
	80 mM	0.0395 mL	0.1973 mL	0.3946 mL	0.9865 mL
	100 mM	0.0316 mL	0.1578 mL	0.3157 mL	0.7892 mL



源叶