



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: **JNJ-18038683**

CAS 号: **851376-05-1**

产品货号: **S89261**

生物活性:

Description	JNJ-18038683 是 5-羟色胺受体 7 (5-HT7) 的拮抗剂, HEK293 细胞中检测出其对大鼠和人类 5-羟色胺受体 7 的 pKi 值分别为 8.19, 8.20。					
IC50 & Target[1]	Rat 5-HT ₇ Receptor 8.19 (pKi, in HEK293 cells)	5-HT ₇ Receptor	Human 5-HT ₇ Receptor 8.20 (pKi, in HEK293 cells)			
In Vitro	JNJ-18038683 以高亲和力取代了大鼠和人 5-HT7 受体在 HEK293 细胞中表达的特异性 [3H]5-CT 结合位点 (pKi 分别为 8.19±0.02 和 8.20±0.01)。大鼠丘脑膜中的天然 5-HT7 也获得了相似的值 (pKi=8.50±0.20)。山岭值接近统一, 表明单点竞争性约束。JNJ-18038683 的拮抗剂效力是通过测量表达人或大鼠 5-HT7 受体的 HEK293 细胞中的腺苷酸环化酶活性来确定的。5-HT 刺激大鼠和人 5-HT7/HEK293 细胞的腺苷酸环化酶活性, pEC50 分别为 8.09 和 8.12。JNJ-18038683 产生 5-HT (100 nM) 刺激的腺苷酸环化酶的浓度依赖性降低。为 JNJ-18038683 确定的 pKB 值与根据 [3H]5-CT 结合确定的相应 Ki 值非常一致研究[1]。					
In Vivo	JNJ-18038683 主要在处理后的前 4 小时内以剂量依赖性方式抑制 REM 睡眠。在口服给药后的前 4 小时内, 从 1 mg/kg 的剂量开始, REM 睡眠的持续时间显著减少 (P<0.05)。同时, REM 睡眠潜伏期往往以剂量相关的方式延长, REM 潜伏期显著增加仅在测试的最高剂量 (10 mg/kg; P<0.05) 时发生。REM 睡眠的这些改变似乎是特定于状态的。进行了一项单独的研究以确定重复施用 JNJ-18038683 7 天是否会导致 EEG 睡眠反应的适应, 特别是在处理过程中和处理停止后大鼠的 REM 睡眠。JNJ-18038683 在进入光照阶段 2 小时后连续 7 天给药 (每天 1 mg/kg sc)。在处理的第 1 天, JNJ-18038683 显著减少了注射前后 8 小时的快速眼动睡眠时间, 并延长了快速眼动睡眠潜伏期。REM 睡眠潜伏期在 7 天的重复处理期间增加, 并在停止处理后的第一个恢复日恢复正常。REM 睡眠时间的显著减少在 7 天的重复处理期间得以维持, 在处理停止后的第一个恢复日出现反弹。在整个处理过程中, NREM 睡眠潜伏期和总 NREM 睡眠时间不受影响[1]。					
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 200 mg/mL (377.38 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)					
	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg		
		Preparing	1 mM	1.8869 mL	9.4345 mL	18.8690 mL
		Stock Solutions	5 mM	0.3774 mL	1.8869 mL	3.7738 mL
			10 mM	0.1887 mL	0.9434 mL	1.8869 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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 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: ≥ 5 mg/mL (9.43 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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: ≥ 5 mg/mL (9.43 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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: ≥ 5 mg/mL (9.43 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 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 50.0 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]. Bonaventure P, et al. Translational evaluation of JNJ-18038683, a 5-hydroxytryptamine type 7 receptor antagonist, on rapid eye movement sleep and in major depressive disorder. J Pharmacol Exp Ther. 2012 Aug;342(2):429-40.
------	--

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, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 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	1.8869 mL	9.4345 mL	18.8690 mL	47.1725 mL
	5 mM	0.3774 mL	1.8869 mL	3.7738 mL	9.4345 mL
	10 mM	0.1887 mL	0.9434 mL	1.8869 mL	4.7172 mL
	15 mM	0.1258 mL	0.6290 mL	1.2579 mL	3.1448 mL
	20 mM	0.0943 mL	0.4717 mL	0.9434 mL	2.3586 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: shyyssw@sina.com

	25 mM	0.0755 mL	0.3774 mL	0.7548 mL	1.8869 mL
	30 mM	0.0629 mL	0.3145 mL	0.6290 mL	1.5724 mL
	40 mM	0.0472 mL	0.2359 mL	0.4717 mL	1.1793 mL
	50 mM	0.0377 mL	0.1887 mL	0.3774 mL	0.9434 mL
	60 mM	0.0314 mL	0.1572 mL	0.3145 mL	0.7862 mL
	80 mM	0.0236 mL	0.1179 mL	0.2359 mL	0.5897 mL
	100 mM	0.0189 mL	0.0943 mL	0.1887 mL	0.4717 mL



源叶