



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-5207852 dihydrochloride

CAS 号: 1782228-76-5

产品货号: S89864

生物活性:

Description	JNJ-5207852 dihydrochloride is a selective and potent histamine H3 receptor (H3R) antagonist, with pKis of 8.9, 9.24 for rat and human H3R, respectively.																				
IC50 & Target	H3 Receptor 8.9 (pKi, for rat)	H3 Receptor 9.24 (pKi, for human)																			
In Vivo	JNJ-5207852 (1-10mg/kg s.c.) increases time spent awake and decreases REM sleep and slow-wave sleep, but fails to have an effect on wakefulness or sleep in H3 receptor knockout mice. The wake promoting effects of this H3 receptor antagonist are not associated with hypermotility. A 4-week daily treatment of mice with JNJ-5207852 (10 mg/kg i.p.) does not lead to a change in body weight. JNJ-5207852 is extensively absorbed after oral administration and reaches high brain levels[1]. <table><tr><td>Animal Model:</td><td>Male, Sprague-Dawley rats weighing 282-334 g[1].</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>3, 10, 30 mg/kg.</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>S.C.</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Iincreased time spent awake and decreased REM sleep and slow-wave sleep.</td></tr></table>				Animal Model:	Male, Sprague-Dawley rats weighing 282-334 g[1].	Dosage:	3, 10, 30 mg/kg.	Administration:	S.C.	Result:	Iincreased time spent awake and decreased REM sleep and slow-wave sleep.									
Animal Model:	Male, Sprague-Dawley rats weighing 282-334 g[1].																				
Dosage:	3, 10, 30 mg/kg.																				
Administration:	S.C.																				
Result:	Iincreased time spent awake and decreased REM sleep and slow-wave sleep.																				
Solvent&Solubility	细胞实验: H2O 中的溶解度 : 25 mg/mL (64.20 mM; 超声助溶) DMSO 中的溶解度 : 7.14 mg/mL (18.34 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) <table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> SolventMassConcentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>2.5681 mL</td><td>12.8403 mL</td><td>25.6805 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.5136 mL</td><td>2.5681 mL</td><td>5.1361 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.2568 mL</td><td>1.2840 mL</td><td>2.5681 mL</td></tr></table> * 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. -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。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。 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: ≥ 0.71 mg/mL (1.82 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.71 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。				Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	2.5681 mL	12.8403 mL	25.6805 mL	5 mM	0.5136 mL	2.5681 mL	5.1361 mL	10 mM	0.2568 mL	1.2840 mL	2.5681 mL
Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg																	
	1 mM	2.5681 mL	12.8403 mL	25.6805 mL																	
	5 mM	0.5136 mL	2.5681 mL	5.1361 mL																	
	10 mM	0.2568 mL	1.2840 mL	2.5681 mL																	



	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 7.1 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq$ 0.71 mg/mL (1.82 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 0.71 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 7.1 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 0.71 mg/mL (1.82 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 0.71 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 7.1 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]. Barbier AJ, et al. Acute wake-promoting actions of JNJ-5207852, a novel, diamine-based H3 antagonist. Br J Pharmacol. 2004 Nov;143(5):649-61. [2]. Abuhamdah RM, et al. Effects of methimepip and JNJ-5207852 in Wistar rats exposed to an open-field with and without object and in Balb/c mice exposed to a radial-arm maze. Front Syst Neurosci. 2012 Jul 16;6:54.

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。 -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/ H ₂ O	1 mM	2.5681 mL	12.8403 mL	25.6805 mL	64.2013 mL
	5 mM	0.5136 mL	2.5681 mL	5.1361 mL	12.8403 mL
	10 mM	0.2568 mL	1.2840 mL	2.5681 mL	6.4201 mL
	15 mM	0.1712 mL	0.8560 mL	1.7120 mL	4.2801 mL
H ₂ O	20 mM	0.1284 mL	0.6420 mL	1.2840 mL	3.2101 mL
	25 mM	0.1027 mL	0.5136 mL	1.0272 mL	2.5681 mL
	30 mM	0.0856 mL	0.4280 mL	0.8560 mL	2.1400 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

	40 mM	0.0642 mL	0.3210 mL	0.6420 mL	1.6050 mL
	50 mM	0.0514 mL	0.2568 mL	0.5136 mL	1.2840 mL
	60 mM	0.0428 mL	0.2140 mL	0.4280 mL	1.0700 mL



源叶