

## JTC-801

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
JTC-801	53995ES10	10 mg
	53995ES50	50 mg

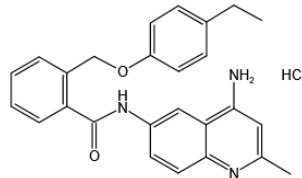
### 产品描述

JTC-801 (JTC801)是 opioid receptor-like1 (ORL1) receptor (阿片受体样 1 受体) 选择性拮抗剂,  $K_i$  值为 8.2 nM,  $IC_{50}$  值为 94 nM。在表达人 ORL1 受体的 HeLa 细胞中, JTC-801 不会抑制毛喉素刺激的环 AMP 积累, 同时会阻止痛敏肽对环 AMP 积累的抑制, 表明 JTC-801 具有完全的拮抗活性。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	JTC-801, JTC801
靶点 (Target)	ORL1 receptor
通路 (Pathway)	GPCR/G Protein--Opioid Receptor
CAS 号 (CAS NO.)	244218-51-7
分子式 (Formula)	$C_{26}H_{26}ClN_3O_2$
分子量 (Molecular Weight)	447.96
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

### 结构式 (Structure)



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-25~-15°C, 有效期 3 年。建议溶解分装后于-25~-15°C干燥保存, 避免反复冻融。

### 注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

### 使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

### 使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

#### (一) 细胞实验 (体外实验)

在表达 ORL1 受体的 HeLa 细胞中，JTC-801 抑制毛喉素诱导的环 AMP 积累，抑制[(3)H]-痛敏素与 ORL1 受体的结合， $K_i$  值为 44.5 nM。<sup>[1]</sup>

## (二) 动物实验 (体内实验)

在小鼠中，静脉给药 JTC-801 可拮抗小鼠痛敏素诱导的异常性疼痛；在鼠标热板测试中，JTC-801 延长了暴露热刺激的逃避反应潜伏期(ERL)。<sup>[1]</sup> 在小鼠中，口服给药 JTC-801 (0.3-3 mg/kg)拮抗痛敏肽诱导的痛觉超敏，并在小鼠的电热板测试和大鼠的福尔马林测试中表现出镇痛效果。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

- [1] Yamada H, et al. Pharmacological profiles of a novel opioid receptor-like1 (ORL(1)) receptor antagonist, JTC-801. *Br J Pharmacol.* 2002 Jan;135(2):323-32.
- [2] Shinkai H, et al. 4-Aminoquinolines: novel nociceptin antagonists with analgesic activity. *J Med Chem.* 2000 Nov 30;43(24):4667-77.