

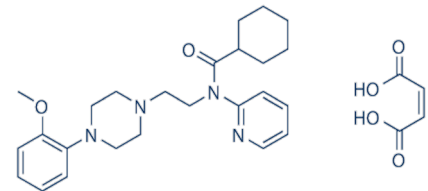
## WAY100635 (5-HT1A拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD9527-10mM	WAY100635 (5-HT1A拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD9527-5mg	WAY100635 (5-HT1A拮抗剂)	5mg
SD9527-25mg	WAY100635 (5-HT1A拮抗剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	(Z)-but-2-enedioic acid;N-[2-[4-(2-methoxyphenyl)piperazin-1-yl]ethyl]-N-pyridin-2-ylcyclohexanecarboxamide
简称	WAY100635
别名	WAY-100635 maleate salt, WAY-100635 maleate, WAY 100635 maleate
中文名	N/A
化学式	C <sub>25</sub> H <sub>34</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> ·C <sub>4</sub> H <sub>4</sub> O <sub>4</sub>
分子量	538.64
CAS号	1092679-51-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 85mg/ml; Ethanol 85mg/ml
溶液配制	5mg加入0.93ml DMSO, 或每5.39mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD9527-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	WAY-100635 Maleate是一种有效的, 选择性的5-HT1A受体激动剂, IC50为0.95nM。				
信号通路	Neuronal Signaling; GPCR & G Protein				
靶点	5-HT	—	—	—	—
IC50	0.95nM	—	—	—	—
体外研究	<p>在灌流WAY 100635(10nM)的中缝背核(DRN)切片中, 大多数假定的5-HT神经元增加了它们的放电率(13%基础放电率)。此外, WAY 100635完全防止5-HT(3-15μM)、8-OH-DPAT(10nM)、5-carboxamidotryptamine(20nM)和lesopitron(100nM)产生的放电率下降。通过将5-HT的浓度增加到300μM, WAY 100635表现出的拮抗作用被完全克服。在海马切片中, WAY 100635(0.5nM-10nM)不改变静息膜电位或细胞内记录的CA1椎体细胞膜输入电阻。然而, WAY 100635不仅完全阻断超极化, IC50为1.3nM, 也会降低5-HT和5-carboxamidotryptamine产生的膜输出电阻, IC50分别为22.5μM和50nM。WAY 100635对5-HT1A位点的IC50为1.35nM, 比作用于一系列其它CNS受体的选择性高100多倍。WAY 100635特异性结合的Bmax一致比其他激动剂放射性配体, [<sup>3</sup>H]8-OH-DPAT高50-60%。Mn<sup>2+</sup>, 而不是鸟嘌呤核苷酸, 抑制[<sup>3</sup>H]WAY 100635特异性结合。WAY 100635没有5-HT1A受体激动剂作用, 但是剂量依赖性阻断海马CA1区域突触后5-HT1A受体和位于中缝背核5-HT神经元上突触5-HT1A受体的激动剂作用。[<sup>3</sup>H]WAY 100635的Kd大约为2.5nM。在离体的豚鼠回肠中, 高浓度WAY 100635是一种有效的, 不能克服的5-carboxamidotryptamine对5-HT1A受体激动作用的拮抗剂, 表观pA2值(0.3nM下)为9.71。[<sup>3</sup>H]WAY 100635(4μCi-7.6μCi/小鼠)静脉注射5分钟后, 全血中氟的量仅占注射放射性的1.5-1.8%, 3H聚集的区域差异与5-HT1A受体密度相关。根据最近发现的多巴胺能活性, 研究中得出结论表明, 采用WAY 100635作为一种选择性5-HT1A拮抗剂, 可能需要重新评估。</p>				
体内研究	<p>[<sup>3</sup>H]WAY 100635对小鼠静脉内给药后, 选择性结合到脑5-HT1A受体。WAY 100635也会剂量依赖性阻断8-OH-DPAT抑制中缝背核5-HT神经元放电, 引起'5-HT综合征', 低体温症, 食欲过剩, 以及提高血浆ACTH水平的能力。在小鼠明/暗箱焦虑模型中, WAY 100635诱导抗焦虑样作用。在大鼠短期记忆延迟匹配信息位置模型中, WAY 100635对认知能力没有内在影响, 但是会逆转8-OH-DPAT对运动神经激动性能的破坏作用。在麻醉的大鼠体内, WAY 100635在自身没有抑制作用的剂量下, 阻断8-OH-DPAT对中缝背核放电的抑制作用。在行为模型中, WAY 100635自身不会诱导明显的大鼠和豚鼠的行为改变, 但是会有效拮抗8-OH-DPAT诱导的行为综合征(最小作用剂量=0.003mg/kg s.c., ID50=0.01mg/kg s.c.)。在</p>				

	小鼠和大鼠体内，WAY 100635也会阻断8-OH-DPAT诱导的低体温症，ID50值为0.01mg/kg s.c。
临床实验	N/A
特征	首个5-HT1A拮抗剂放射性配体。

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献，碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	神经元
浓度	1nM-5nM
处理时间	2分钟-5分钟
方法	细胞外记录通过充满2M NaCl (12MΩ-15MΩ)的玻璃微电极制备。将具有以下标准的细胞视为5-HT神经元:2毫秒到3毫秒持续时间的双向动作电位，缓慢(0.5Hz-2.0Hz)且有规律的放电模式。通过将alpha-1肾上腺素能激动剂phenylephrine (3μM)加入灌流的ACSF，诱发其他沉默神经元的放电。使用不同药物之前，基线活性至少记录10分钟。该信号被馈送到高输入阻抗放大器，一个示波器和一个由单个动作电位引发的，与A/D转换器和个人计算机连接的电子速率计。使用专用软件，记录综合放电率，以连续10秒的样品在图表记录器上计算和显示。激动剂的作用通过使用WAY 100635之前2分钟的记录和WAY 100635动作峰值的记录(通常在应用开始后2-5分钟)比较平均放电频率。当激动剂在拮抗剂存在下使用时，激动剂的作用相当于基础放电率和单独灌流拮抗剂时记录的频率。重新测试激动剂作用前，将拮抗剂平衡10-25分钟。

动物实验	
动物模型	体重为25-30g的雄性CD1小鼠
配制	0.9% NaCl
剂量	250μl (30.4μCi/ml)
给药方式	通过静脉注射给药

➤ 参考文献:

- 1.Corradetti R, et al. J Pharmacol Exp Ther. 1996, 278(2), 679-688.
- 2.Fletcher A, et al. Behav Brain Res. 1996, 73(1-2), 337-353.
- 3.Hall H, et al. Brain Res. 1997, 745(1-2), 96-108.
- 4.Forster EA, et al. Eur J Pharmacol. 1995, 281(1), 81-88.
- 5.Laporte AM, et al. Eur J Pharmacol. 1994, 271(2-3), 505-514.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD9527-10mM	WAY100635 (5-HT1A拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD9527-5mg	WAY100635 (5-HT1A拮抗剂)	5mg
SD9527-25mg	WAY100635 (5-HT1A拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页:

