

WAY-100635 Maleate

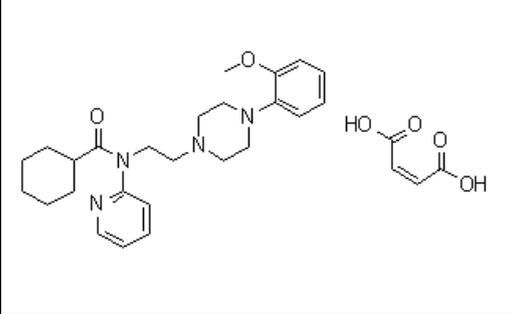
产品编号：MB3737

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C ₂₅ H ₃₄ N ₄ O ₂ .C ₄ H ₄ O ₄	结构式	
分子量	538.64		
CAS No.	1092679-51-0		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 85 mg/mL (157.8 mM) Water : Insoluble Ethanol : 85 mg/mL (157.8 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：WAY-100635 Maleate 是有效的，5-HT_{1A} 的选择性抑制剂。

别名：Cyclohexanecarboxamide, N-[2-[4-(2-methoxyphenyl)-1-piperazinyl]ethyl]-N-2-pyridinyl-, (2Z)-2-butenedioate (1:1)

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 85 mg/mL (157.8 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 85 mg/mL (157.8 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	WAY-100635 Maleate 是一种有效的，选择性的 5-HT _{1A} 受体拮抗剂，IC ₅₀ 为 0.95 nM。
特性	首个 5-HT _{1A} 拮抗剂放射性配体。
靶点	5-HT 0.95 nM

<p>体外研究</p>	<p>在灌流 WAY 100635 (10 nM)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 (3-15 μM), 8-OH-DPAT (10 nM), 5-carboxamidotryptamine (20 nM)和 lesopitron (100 nM)产生的放电率下降。通过将 5-HT 的浓度增加到 300 μM, WAY 100635 表现出的拮抗作用被完全克服。在海马切片中, WAY 100635 (0.5 nM -10 nM)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 1.3 nM, 也会降低 5-HT 和 5-carboxamidotryptamine 产生的膜输出电阻, IC50 分别为 22.5 μM 和 50 nM。WAY 100635 对 5-HT1A 位点的 IC50 为 1.35 nM, 比作用于一系列其它的 CNS 受体的选择性高 100 多倍。[³H]WAY 100635 特异性结合的 Bmax 一致比其他激动剂放射性配体, [³H]8-OH-DPAT 高 50-60%。Mn²⁺, 而不是鸟嘌呤核苷酸, 抑制[³H]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。[³H]WAY 100635 的 K_d 大约为 2.5 nM。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(0.3 nM 下)为 9.71。[³H]WAY 100635 (4 μCi -7.6 μCi/小鼠)静脉注射 5 分钟后, 全血中气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, 研究中得到结论表明, 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>
<p>体内研究</p>	<p>[³H]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= 0.003 mg/kg s.c., ID50 = 0.01 mg/kg s.c.)。在小鼠和大鼠体内, WAY 100635 也会阻断 8-OH-DPAT 诱导的低体温症, ID50 值为 0.01 mg/kg s.c。</p>

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3671	SB742457
MB3795	VUF 10166
MB3670	普卡必利

用途及描述 : 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。WAY-100635 Maleate 是有效的, 5-HT_{1A} 的选择性抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg

1 mM	1.8565 mL	9.2826 mL	18.5653 mL
5 mM	0.3713 mL	1.8565 mL	3.7131 mL
10 mM	0.1857 mL	0.9283 mL	1.8565 mL
50 mM	0.0371 mL	0.1857 mL	0.3713 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验 :	<p>Cell lines: 神经元</p> <p>Concentrations: 1 nM -5 nM</p> <p>Incubation Time: 2 分钟-5 分钟</p> <p>Method:</p> <p>细胞外记录通过充满 2 M NaCl (12 MΩ-15 MΩ)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(0.5 Hz - 2.0 Hz)且有规律的放电模式。通过将 alpha-1 肾上腺素能激动剂 phenylephrine (3 μM)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。该电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。</p>
动物实验 :	<p>Animal Models: 体重为 25-30 g 的雄性 CD1 小鼠</p> <p>Formulation: 0.9% NaCl</p> <p>Dosages: 250 μL (30.4 μCi/mL)</p> <p>Administration: 通过静脉注射给药</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装 : 您收到货物后最好不要自己进行分包, 因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质; 如您有特殊包装要求, 请在订购时候与我们客服代表阐明, 当然价格会做适当调整。对于开盖后,

长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围

1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
> 1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。