



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: **GSK189254A**
CAS 号: **720690-73-3**
产品货号: **S86320**

生物活性:				
Description	GSK189254A (GSK189254 free base)是一个新颖高效有选择性的 H3 受体拮抗剂, 对人类和大鼠 H3 的 pKi 值分别为 9.59-9.90 and 8.51-9.17。			
IC50 & Target	H3 receptor			
In Vitro	GSK189254 对 HEK-293-MSR-II 细胞中表达的重组 H3 受体以及在多个物种大脑皮层中表达的天然 H3 受体均具有高亲和力。与大鼠、小鼠和犬的 H3 受体相比, GSK189254 对人类和猪的 H3 受体通常表现出更高的亲和力。[3H]GSK189254 可与大鼠和人类的大脑区域结合, 包括皮层和海马体。GSK189254 可能具有治疗阿尔茨海默病痴呆症和其他认知障碍的对症治疗潜力[1]。			
In Vivo	GSK189254 (0.3-3 mg/kg 口服) 可增加前扣带皮层中乙酰胆碱、去甲肾上腺素和多巴胺的释放, 以及背侧海马中乙酰胆碱的释放。GSK189254 显著提高大鼠在多种认知范式中的表现, 包括被动回避、水迷宫、物体识别和注意定点转移[1]。 在 O_x+/- 和 O_x-/- 小鼠中, 急性给予 GSK189254 可增加 W 并减少慢波睡眠和异相睡眠, 其程度与莫达非尼相似, 同时可减少 O_x-/- 小鼠的发作性睡眠病发作[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (71.14 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)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.8454 mL	14.2272 mL
		5 mM	0.5691 mL	2.8454 mL
		10 mM	0.2845 mL	1.4227 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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: ≥ 2.5 mg/mL (7.11 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (7.11 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (7.11 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Medhurst AD, et al. GSK189254, a novel H3 receptor antagonist that binds to histamine H3 receptors in Alzheimer's disease brain and improves cognitive performance in preclinical models. J Pharmacol Exp Ther. 2007 Jun;321(3):1032-45. [2]. Guo RX, et al. Differential effects of acute and repeat dosing with the H3 antagonist GSK189254 on the sleep-wake cycle and narcoleptic episodes in Ox-/- mice.Br J Pharmacol. 2009 May;157(1):104-17.

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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.8454 mL	14.2272 mL	28.4544 mL	71.1359 mL
	5 mM	0.5691 mL	2.8454 mL	5.6909 mL	14.2272 mL
	10 mM	0.2845 mL	1.4227 mL	2.8454 mL	7.1136 mL
	15 mM	0.1897 mL	0.9485 mL	1.8970 mL	4.7424 mL
	20 mM	0.1423 mL	0.7114 mL	1.4227 mL	3.5568 mL
	25 mM	0.1138 mL	0.5691 mL	1.1382 mL	2.8454 mL
	30 mM	0.0948 mL	0.4742 mL	0.9485 mL	2.3712 mL
	40 mM	0.0711 mL	0.3557 mL	0.7114 mL	1.7784 mL
	50 mM	0.0569 mL	0.2845 mL	0.5691 mL	1.4227 mL
	60 mM	0.0474 mL	0.2371 mL	0.4742 mL	1.1856 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



源叶