



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: shyyssw@sina.com

产品名称: 8-OH-DPAT
CAS 号: 78950-78-4
产品货号: S88183

生物活性:

Description	8-OH-DPAT 是一种有效的, 选择性的 5-HT 激动剂, 对 5-HT1A 的 pIC50 值为 8.19, 对 5-HT7 的 Ki 值为 466 nM, 对 5-HT1B (pIC50, 5.42) 和 5-HT (pIC50 <5) 的作用很弱。				
IC50 & Target	5-HT1A Receptor	5-HT1B Receptor	5-HT7 Receptor	5-HT1A Receptor	5-HT7 Receptor
				8.19 (pIC50)	466 nM (Ki)
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	CHO	EC50	260 nM	The intrinsic activity was evaluated for its ability to inhibit forskolin-stimulated c-AMP formation mediated by cloned 5-hydroxytryptamine 1B receptor in CHO cell line	
	CHO	IC50	5.2 nM	Binding affinity to rat Dopamine receptor D2 expressed in CHO cells was determined using [125 I] iodosulpride as radioligand	
	HEK293	IC50	5.3 x 10 ⁻¹⁰ M	Displacement of [3H]8-OH-DPAT from human recombinant 5HT1A receptor expressed in HEK293 cells measured after 60 mins by scintillation counting method	
	HEK293	EC50	6 nM	Agonist activity at human 5 HT1A receptor expressed in HEK293 cells assessed as inhibition of forskolin-stimulated cAMP accumulation incubated for 30 mins by TR-FRET assay	
	HeLa	EC50	8 nM	Agonist activity at human 5-HT1A receptor expressed in human HeLa cells assessed as inhibition of forskolin-stimulated cAMP formation after 10 mins by RIA	
In Vitro	8-OH-DPAT 是一种有效的选择性 5-HT 激动剂, 对 5-HT1A 的 pIC50 为 8.19; 与 5-HT1B (pIC50, 5.42)、5-HT (pIC50 <5)弱结合[1]。 8-OH-DPAT 对 5-HT7 具有高亲和力, Ki 为 466 nM, 并且不与 5-HT6 或 5-HT4 结合[2]。				
In Vivo	8-OH-DPAT (1 mg/kg) 使运动减退正常化, 显著增加觉醒并减少 REM 睡眠的持续时间, 而不影响食欲素敲除 (KO) 小鼠在黑暗时期的非 REM 睡眠持续时间。8-OH-DPAT 对 WT 小鼠的觉醒或 REM 睡眠或非 REM 睡眠的持续时间没有明显影响。8-OH-DPAT (1 mg/kg, 皮下注射) 激活食欲素敲除小鼠的 5-HT1A 受体[3]。				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (404.24 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	10 mg
		1 mM	4.0424 mL	20.2118 mL	40.4236 mL
		5 mM	0.8085 mL	4.0424 mL	8.0847 mL
10 mM		0.4042 mL	2.0212 mL	4.0424 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: $\geq 5 \text{ mg/mL}$ (20.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 5 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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: $\geq 5 \text{ mg/mL}$ (20.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 5 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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: $\geq 5 \text{ mg/mL}$ (20.21 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 5 \text{ mg/mL}$ (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 50.0 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]. DEREK N. MIDDLEMISS, et al. 8-HYDROXY-2-(DI-n-PROPYLAMINO)-TETRALIN DISCRIMINATES BETWEEN SUBTYPES OF [2]. Bard JA, et al. Cloning of a novel human serotonin receptor (5-HT7) positively linked to adenylate cyclase. J Biol Chem. 1993 Nov 5;268(31):23422-6. [3]. Mori T, et al. Narcolepsy-like sleep disturbance in orexin knockout mice are normalized by the 5-HT1A receptor agonist 8-OH-DPAT. Psychopharmacology (Berl). 2016 Jun;233(12):2343-53.
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。	



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: shyyssw@sina.com

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	4.0424 mL	20.2118 mL	40.4236 mL	101.0591 mL
	5 mM	0.8085 mL	4.0424 mL	8.0847 mL	20.2118 mL
	10 mM	0.4042 mL	2.0212 mL	4.0424 mL	10.1059 mL
	15 mM	0.2695 mL	1.3475 mL	2.6949 mL	6.7373 mL
	20 mM	0.2021 mL	1.0106 mL	2.0212 mL	5.0530 mL
	25 mM	0.1617 mL	0.8085 mL	1.6169 mL	4.0424 mL
	30 mM	0.1347 mL	0.6737 mL	1.3475 mL	3.3686 mL
	40 mM	0.1011 mL	0.5053 mL	1.0106 mL	2.5265 mL
	50 mM	0.0808 mL	0.4042 mL	0.8085 mL	2.0212 mL
	60 mM	0.0674 mL	0.3369 mL	0.6737 mL	1.6843 mL
	80 mM	0.0505 mL	0.2526 mL	0.5053 mL	1.2632 mL
	100 mM	0.0404 mL	0.2021 mL	0.4042 mL	1.0106 mL

源叶