



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: **WAY-181187**

CAS 号: **554403-49-5**

产品货号: **S89113**

生物活性:					
Description	WAY-181187 (SAX-187) 是一种有效的选择性 5-HT6 受体激动剂, Ki 为 2.2 nM, EC50 为 6.6 nM。WAY181187 介导 5-HT6 受体依赖性信号通路, 如 cAMP, Fyn 和 ERK1/2 激酶, 作为特异性激动剂。				
IC50 & Target[1]	5-HT6 Receptor	5-HT6 Receptor 2.2 nM (Ki)	5-HT6 Receptor 6.6 nM (EC50)		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HeLa	EC50	6.5 nM	Agonist activity at human 5HT6 receptor expressed in HeLa cells assessed as cAMP production	
	HeLa	EC50	6.5 nM	Agonist activity at human 5HT6 receptor expressed in HeLa cells assessed as induction of cAMP production after 10 mins by radioimmunoassay	
In Vitro	WAY181187 (1 和 10 μM) 增加 ERK1/2 的激活。WAY181187 还增加 Fyn 激酶活性[2]。Western Blot Analysis[2]				
	Cell Line:		HEK/HA-5-HT6 receptor cells		
	Concentration:		1 and 10 μM		
	Incubation Time:		Pretreatment 5 minutes		
	Result:		Increased activation of ERK1/2 both at 1 and 10 μM concentrations.		
In Vivo	急性给予 WAY-181187 (3-30 mg/kg, sc) 显著增加细胞外 GABA 浓度, 而不改变大鼠额叶皮质中谷氨酸或去甲肾上腺素的水平。此外, WAY-181187 (30 mg/kg, 皮下注射) 可适度但显著降低皮质多巴胺和 5-HT 水平[1]。				
	Animal Model:		Adult male Sprague-Dawley rats weighing 280–350 g[1]		
	Dosage:		3, 10, or 30 mg/kg		
	Administration:		Acute dministered by s.c.		
	Result:		Significantly increased extracellular GABA concentrations without altering the levels of glutamate or norepinephrine.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (262.56 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 Concentration	Mass	1 mg	5 mg
		1 mM		2.6256 mL	13.1278 mL
		5 mM		0.5251 mL	2.6256 mL
10 mM			0.2626 mL	1.3128 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, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。					
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 (6.56 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 (6.56 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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 (6.56 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]. Lee E Schechter, et al. Neuropharmacological Profile of Novel and Selective 5-HT6 Receptor Agonists: WAY-181187 and WAY-208466. Neuropsychopharmacology. 2008 May;33(6):1323-35. [2]. Teresa Riccioni, et al. ST1936 Stimulates cAMP, Ca2+, ERK1/2 and Fyn Kinase Through a Full Activation of Cloned Human 5-HT6 Receptors. Eur J Pharmacol. 2011 Jul 1;661(1-3):8-14.

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, 6 months; -20° C, 1 month。-80° C 储存时，请在 6 个月内使用，-20° C 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				
DMSO	1 mM	2.6256 mL	13.1278 mL	26.2557 mL	65.6392 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: shyyssw@sina.com

	5 mM	0.5251 mL	2.6256 mL	5.2511 mL	13.1278 mL
	10 mM	0.2626 mL	1.3128 mL	2.6256 mL	6.5639 mL
	15 mM	0.1750 mL	0.8752 mL	1.7504 mL	4.3759 mL
	20 mM	0.1313 mL	0.6564 mL	1.3128 mL	3.2820 mL
	25 mM	0.1050 mL	0.5251 mL	1.0502 mL	2.6256 mL
	30 mM	0.0875 mL	0.4376 mL	0.8752 mL	2.1880 mL
	40 mM	0.0656 mL	0.3282 mL	0.6564 mL	1.6410 mL
	50 mM	0.0525 mL	0.2626 mL	0.5251 mL	1.3128 mL
	60 mM	0.0438 mL	0.2188 mL	0.4376 mL	1.0940 mL
	80 mM	0.0328 mL	0.1641 mL	0.3282 mL	0.8205 mL
	100 mM	0.0263 mL	0.1313 mL	0.2626 mL	0.6564 mL

