



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: PD 168077 MALEATE

CAS 号: 630117-19-0

产品货号: S87843

|                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                      |           |            |            |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------|-----------|------------|------------|
| 生物活性:                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                      |           |            |            |
| Description                                                                                                                           | PD-168077 maleate 是一个选择性的多巴胺 D4 受体激动剂, 其 Ki 值为 9 nM。                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                      |           |            |            |
| IC50 & Target                                                                                                                         | D4 Receptor                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                      |           |            |            |
| In Vitro                                                                                                                              | PD-168077 是最早被确定为选择性 D4 激动剂的药物之一。它比 D2 样受体家族的其他成员及其 D1 样受体显示出 >100 倍的选择性; PD-168077 对 α1 和 α2 的选择性是 20 倍, 对 5-HT1A 的选择性是 45 倍, 并且选择性是 5-HT2A 受体的 460 倍; PD-168077 证明 D4 受体在 CHO 细胞中类似唑吡罗抑制毛喉素刺激的 cAMP 积累或刺激[3H]胸苷摄取方面的内在活性表达人类 D4 受体 [1]。在 PD-168077 处理的细胞中, p-CaMKII 在突触位点表现出显著增加的聚集, 如与 PSD-95 增强的共定位所示[2]。 |                                                                      |           |            |            |
| In Vivo                                                                                                                               | PD-168077 (0.2-25.0 mg/kg) 剂量依赖性地诱导运动, 其采取不寻常的特征性“洗牌”形式, 包括不协调的运动以及打哈欠和肌阵挛性抽搐发作; 减少梳理和饲养[1]。                                                                                                                                                                                                                  |                                                                      |           |            |            |
| Solvent&Solubility                                                                                                                    | 细胞实验:                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                      |           |            |            |
|                                                                                                                                       | DMSO 中的溶解度 : 150 mg/mL (332.97 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)                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                      |           |            |            |
|                                                                                                                                       | H2O 中的溶解度 : 2 mg/mL (4.44 mM; 超声助溶 (<60°C))                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                      |           |            |            |
|                                                                                                                                       | Preparing Stock Solutions                                                                                                                                                                                                                                                                                     | <div><div>Solvent</div><div>Mass</div><div>Concentration</div></div> | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
|                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | 1 mM                                                                 | 2.2198 mL | 11.0990 mL | 22.1981 mL |
|                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | 5 mM                                                                 | 0.4440 mL | 2.2198 mL  | 4.4396 mL  |
|                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | 10 mM                                                                | 0.2220 mL | 1.1099 mL  | 2.2198 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 (sealed storage, away from moisture)。-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。                                                                                                                                                                               |                                                                      |           |            |            |
|                                                                                                                                       | * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                                      |           |            |            |
| 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 (5.55 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 ddH <sub>2</sub> O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                                      |           |            |            |



|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
|------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>方案 二</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)</p> <p>Solubility: <math>\geq 2.5</math> mg/mL (5.55 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 2.5</math> mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 <math>\mu</math>L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。</p> <p>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。</p> <p>方案 三</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil</p> <p>Solubility: <math>\geq 2.5</math> mg/mL (5.55 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 2.5</math> 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。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 <math>\mu</math>L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 玉米油中, 混合均匀。</p> |
| 参考文献 | <p>[1]. Clifford JJ, et al. Topographically based search for an "Ethogram" among a series of novel D(4) dopamine receptor agonists and antagonists. Neuropsychopharmacology. 2000 May;22(5):538-44.</p> <p>[2]. Gu Z, et al. Activation of dopamine D4 receptors induces synaptic translocation of Ca<sup>2+</sup>/calmodulin-dependent protein kinase II in cultured prefrontal cortical neurons. Mol Pharmacol. 2006 Mar;69(3):813-22.</p>                                                                                                                                                                                                                                                              |

#### 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 (sealed storage, away from moisture)。-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<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|-------------------------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
| H <sub>2</sub> O / DMSO | 1 mM             | 2.2198 mL | 11.0990 mL | 22.1981 mL | 55.4951 mL |
| DMSO                    | 5 mM             | 0.4440 mL | 2.2198 mL  | 4.4396 mL  | 11.0990 mL |
|                         | 10 mM            | 0.2220 mL | 1.1099 mL  | 2.2198 mL  | 5.5495 mL  |
|                         | 15 mM            | 0.1480 mL | 0.7399 mL  | 1.4799 mL  | 3.6997 mL  |
|                         | 20 mM            | 0.1110 mL | 0.5550 mL  | 1.1099 mL  | 2.7748 mL  |
|                         | 25 mM            | 0.0888 mL | 0.4440 mL  | 0.8879 mL  | 2.2198 mL  |
|                         | 30 mM            | 0.0740 mL | 0.3700 mL  | 0.7399 mL  | 1.8498 mL  |
|                         | 40 mM            | 0.0555 mL | 0.2775 mL  | 0.5550 mL  | 1.3874 mL  |
|                         | 50 mM            | 0.0444 mL | 0.2220 mL  | 0.4440 mL  | 1.1099 mL  |
|                         | 60 mM            | 0.0370 mL | 0.1850 mL  | 0.3700 mL  | 0.9249 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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

|  |               |           |           |           |           |
|--|---------------|-----------|-----------|-----------|-----------|
|  | <b>80 mM</b>  | 0.0277 mL | 0.1387 mL | 0.2775 mL | 0.6937 mL |
|  | <b>100 mM</b> | 0.0222 mL | 0.1110 mL | 0.2220 mL | 0.5550 mL |

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22  $\mu\text{m}$  的滤膜过滤除菌后使用。



源叶