



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: **A-381393**  
CAS 号: **726174-00-1**  
产品货号: **S88707**

**生物活性:**

|                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                         |                             |                                                                                                   |
|-------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------|-----------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <b>Description</b>            | A-381393 是一种有效、选择性、可透过血脑屏障的 dopamine D4 receptor 拮抗剂, 对人 dopamine D4.4, D4.2 和 D4.7 受体的 Ki 值分别为 1.5, 1.9 和 1.6 nM, 选择性是对 D1, D2, D3, D5 多巴胺受体的 2700 多倍。A-381393 对 5-HT2A 的选择性适中, Ki 值为 370 nM。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                         |                             |                                                                                                   |
| <b>IC50 &amp; Target</b>      | D <sub>3</sub> Receptor                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | D <sub>4</sub> Receptor | 5-HT <sub>2A</sub> Receptor |                                                                                                   |
| <b>Cellular Effect</b>        | <b>Cell Line</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | <b>Type</b>             | <b>Value</b>                | <b>Description</b>                                                                                |
|                               | HEK293                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | IC <sub>50</sub>        | 5 nM                        | In vitro inhibitory concentration tested on human D4.4 receptor in HEK293 cells using FLIPR assay |
| <b>In Vitro</b>               | A-381393 在 5-HT1A、Sigma 2、腺受体 α 1A、腺受体 α 2C、组胺 H1 中的 Ki 分别为 1365、8600、2044、1912 和 2962 nM[1]。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                         |                             |                                                                                                   |
| <b>Solvent&amp;Solubility</b> | <b>细胞实验:</b><br>DMSO 中的溶解度 : 51.67 mg/mL (161.25 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)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                         |                             |                                                                                                   |
|                               | <b>Preparing Stock Solutions</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | <b>Solvent</b>          | <b>Mass</b>                 | <b>Concentration</b>                                                                              |
|                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | <b>1 mg</b>             |                             |                                                                                                   |
|                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | <b>5 mg</b>             |                             |                                                                                                   |
|                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | <b>10 mg</b>            |                             |                                                                                                   |
|                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | 1 mM                    | 3.1208 mL                   | 15.6040 mL                                                                                        |
|                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | 5 mM                    | 0.6242 mL                   | 3.1208 mL                                                                                         |
|                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | 10 mM                   | 0.3121 mL                   | 1.5604 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。<br>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。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                         |                             |                                                                                                   |
|                               | <b>动物实验:</b><br>请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。<br>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:<br>——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;<br>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<br>方案 一<br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline<br>Solubility: ≥ 2.58 mg/mL (8.05 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 ≥ 2.58 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.8 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。<br>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。<br>方案 二<br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) |                         |                             |                                                                                                   |
|                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                         |                             |                                                                                                   |



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

|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>Solubility: <math>\geq 2.58</math> mg/mL (8.05 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 2.58</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 25.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 20% 的 SBE-<math>\beta</math>-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。</p> <p>2 g SBE-<math>\beta</math>-CD (磺丁基醚 <math>\beta</math>-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 <math>\rightarrow</math> 90% Corn Oil</p> <p>Solubility: <math>\geq 2.58</math> mg/mL (8.05 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 2.58</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 25.8 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 | [1]. Nakane M, et al. 2-[4-(3,4-Dimethylphenyl)piperazin-1-ylmethyl]-1H benzoimidazole (A-381393), a selective dopamine D4 receptor antagonist. Neuropharmacology. 2005 Jul;49(1):112-21                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |

#### 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<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM             | 3.1208 mL | 15.6040 mL | 31.2081 mL | 78.0202 mL |
|      | 5 mM             | 0.6242 mL | 3.1208 mL  | 6.2416 mL  | 15.6040 mL |
|      | 10 mM            | 0.3121 mL | 1.5604 mL  | 3.1208 mL  | 7.8020 mL  |
|      | 15 mM            | 0.2081 mL | 1.0403 mL  | 2.0805 mL  | 5.2013 mL  |
|      | 20 mM            | 0.1560 mL | 0.7802 mL  | 1.5604 mL  | 3.9010 mL  |
|      | 25 mM            | 0.1248 mL | 0.6242 mL  | 1.2483 mL  | 3.1208 mL  |
|      | 30 mM            | 0.1040 mL | 0.5201 mL  | 1.0403 mL  | 2.6007 mL  |
|      | 40 mM            | 0.0780 mL | 0.3901 mL  | 0.7802 mL  | 1.9505 mL  |
|      | 50 mM            | 0.0624 mL | 0.3121 mL  | 0.6242 mL  | 1.5604 mL  |
|      | 60 mM            | 0.0520 mL | 0.2601 mL  | 0.5201 mL  | 1.3003 mL  |
|      | 80 mM            | 0.0390 mL | 0.1951 mL  | 0.3901 mL  | 0.9753 mL  |
|      | 100 mM           | 0.0312 mL | 0.1560 mL  | 0.3121 mL  | 0.7802 mL  |