



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: **L-765314**
CAS 号: **189349-50-6**
产品货号: **S89036**

生物活性:

Description	L-765314 是 $\alpha 1b$ 肾上腺素能受体 ($\alpha 1b$ adrenergic receptor) 的一个有效的、选择性拮抗剂, 其在大鼠和人体中的 K_i 值分别为 5.4 nM 和 2.0 nM。
IC50 & Target	K_i : 5.4 nM (rat $\alpha 1b$ receptor), 2.0 nM (human $\alpha 1b$ receptor), 50 (rat $\alpha 1d$ receptor), 34 nM (human $\alpha 1d$ receptor), 500 nM (rat $\alpha 1a$ receptor), 420 nM (human $\alpha 1a$ receptor)[1]
In Vitro	L-765314 展示了两个位移位点。高亲和力位点约占结合 (IC50) 1.90 nM 的 25%, 代表与 $R1b$ 位点的结合。低亲和力位点占剩余 75% 的结合 (IC50) 790 nM, 代表与 $R1a$ 位点的结合[1]。
In Vivo	血浆液相色谱/质谱仪 (LCMS) 分析结果表明, L-765314 (A322312) 的平均 C_{max} 为 1.05 μM , $t_{1/2}$ 为 0.5 小时。L-765314 显示抑制对去氧肾上腺素或 A-61603 的升压反应的弱效能 ($AD_{25} > 3$ mg/kg)。基于抑制对 $R1a$ 亚型选择性激动剂 A-61603 的升压反应, L-765314 似乎对 $R1a$ 受体具有选择性, 剂量高达 0.3 mg/kg。大鼠降压效力的结果表明, L-765314 和特拉唑嗪均倾向于降低心率 (在 1 mg/kg 静脉注射时约为 25 bpm)[1]。

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (95.68 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)

	Solvent Concentration	Mass		
		1 mg	5 mg	10 mg
Preparing Stock Solutions	1 mM	1.9135 mL	9.5675 mL	19.1351 mL
	5 mM	0.3827 mL	1.9135 mL	3.8270 mL
	10 mM	0.1914 mL	0.9568 mL	1.9135 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: $-80^{\circ}C$, 2 years; $-20^{\circ}C$, 1 year. $-80^{\circ}C$ 储存时, 请在 2 年内使用, $-20^{\circ}C$ 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 $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.78 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 (4.78 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 (4.78 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]. Patane MA, et al. 4-Amino-2-[4-[1-(benzyloxycarbonyl)-2(S)-[[[(1,1-dimethylethyl)amino]carbonyl]-piperazinyl]-6, 7-dimethoxyquinazoline (L-765,314): a potent and selective alpha1b adrenergic receptor antagonist. J Med Chem. 1998 Apr 9;41(8):1205-8. [2]. Tobias Böhmer, et al. The α1B-adrenoceptor subtype mediates adrenergic vasoconstriction in mouse retinal arterioles with damaged endothelium. Br J Pharmacol. 2014 Aug; 171(16): 3858–3867.

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	1.9135 mL	9.5675 mL	19.1351 mL	47.8377 mL
	5 mM	0.3827 mL	1.9135 mL	3.8270 mL	9.5675 mL
	10 mM	0.1914 mL	0.9568 mL	1.9135 mL	4.7838 mL
	15 mM	0.1276 mL	0.6378 mL	1.2757 mL	3.1892 mL
	20 mM	0.0957 mL	0.4784 mL	0.9568 mL	2.3919 mL
	25 mM	0.0765 mL	0.3827 mL	0.7654 mL	1.9135 mL
	30 mM	0.0638 mL	0.3189 mL	0.6378 mL	1.5946 mL
	40 mM	0.0478 mL	0.2392 mL	0.4784 mL	1.1959 mL
	50 mM	0.0383 mL	0.1914 mL	0.3827 mL	0.9568 mL
	60 mM	0.0319 mL	0.1595 mL	0.3189 mL	0.7973 mL
	80 mM	0.0239 mL	0.1196 mL	0.2392 mL	0.5980 mL