



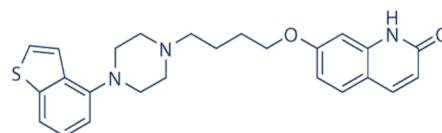
## Brexpiprazole (Dopamine Receptor激动剂)

产品编号	产品名称	包装
SD9563-10mM	Brexpiprazole (Dopamine Receptor激动剂)	10mM×0.2ml
SD9563-5mg	Brexpiprazole (Dopamine Receptor激动剂)	5mg
SD9563-25mg	Brexpiprazole (Dopamine Receptor激动剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	7-[4-[4-(1-benzothiophen-4-yl)piperazin-1-yl]butoxy]-1H-quinolin-2-one
简称	Brexpiprazole
别名	OPC-34712, Rexulti, GTPL7672
中文名	依匹唑派
化学式	C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S
分子量	433.57
CAS号	913611-97-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 24mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.15ml DMSO, 或每4.34mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD9563-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Brexpiprazole is a novel D2 dopamine and serotonin 1A partial agonist, called serotonin-dopamine activity modulator (SDAM), and a potent antagonist of serotonin 2A receptors, noradrenergic alpha 1B and 2C receptors.				
信号通路	Neuronal Signaling; GPCR & G Protein				
靶点	5-HT1A	human noradrenergic α1B	Dopamine D2L	5-HT2A receptors	α2C receptors
IC50	0.12nM(Ki)	0.17nM(Ki)	0.3nM(Ki)	0.47nM(Ki)	0.59nM(Ki)
体外研究	Brexpiprazole is a potent partial agonist at human 5-hydroxytryptamine (5-HT) 5-HT1A (Ki=0.12nM) and dopamine D2L (Ki=0.3nM) receptors, and an antagonist at 5-HT2A receptors (Ki=0.47nM). It also shows potent antagonist activity at human noradrenergic α1B (Ki=0.17nM) and α2Creceptors (Ki=0.59nM). Furthermore, this drug displays moderate affinity for human D3, 5-HT2B and 5-HT7 receptors, as well as α1A, and α1D adrenergic receptors. Brexpiprazole potentiatedngF-induced neurite outgrowth in PC12 cells. It could significantly potentiate the effects of fluoxetine (or paroxetine) on neurite outgrowth.				
体内研究	Brexpiprazole is able to ameliorate PCP-191 induced cognitive deficits in mice, via 5-HT1A receptors.				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	PC12 cells
浓度	0.001, 0.01, 0.1或1.0μM
处理时间	4 days
方法	2.5ng/ml of ngF (nerve growth factor) is used to study the potentiating effects of brexpiprazole on neurite outgrowth. Twenty-four hours after plating, the medium is replaced with DMEM medium containing 0.5% FBS and 1% penicillin-streptomycin withngF (2.5ng/ml), with or without brexpiprazole (0.001, 0.01, 0.1 or 1.0μM).

	Four days after incubation withngF (2.5ng/ml) with or without drugs, morphometric analysis is performed on digitized images of live cells taken under phase-contrast illumination, with an inverted microscope linked to a camera.
--	--

动物实验	
动物模型	Male ICR mice
配制	0.5% methylcellulose
剂量	0.3, 1, or 3mg/kg/day
给药方式	oral administration

➤ **参考文献:**

- 1.Ishima T, et al. Eur Neuropsychopharmacol. 2015, 25(4):505-511.
- 2.Yoshimi N, et al. Pharmacol Biochem Behav. 2014, 124:245-249.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD9563-10mM	Brexpiprazole (Dopamine Receptor激动剂)	10mM×0.2ml
SD9563-5mg	Brexpiprazole (Dopamine Receptor激动剂)	5mg
SD9563-25mg	Brexpiprazole (Dopamine Receptor激动剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01