

## Deschloroclozapine

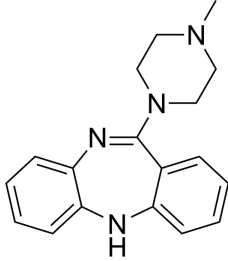
产品编号: MC2042

质量标准: ≥99%,BR

包装规格: 5mg / 10mg / 50mg / 100mg

产品形式: 固体

### 基本信息

分子式	C <sub>18</sub> H <sub>20</sub> N <sub>4</sub>	结构式	
分子量	292.38		
CAS No.	1977-07-7		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	甲醇、乙醇、DMF、DMSO: 33mg/mL Water: insolubility		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介:** Deschloroclozapine 是氯氮平的代谢物, 是一种高效的毒蕈碱 DREADDs 激动剂。Deschloroclozapine 对 DREADD 受体亚型 hM3Dq 和 hM4Di 结合 K<sub>i</sub> 值分别为 6.3 和 4.2 nM。[<sup>11</sup>C]-Deschloroclozapine 是一种有前途的 PET 示踪剂, 可用于 DREADD 的影像学检查。

**别名:** Deschloroclozapine

### 物理性状及指标:

外观: .....淡黄色至黄色固体

纯度: .....≥99%

澄清度: .....甲醇中澄清, 无杂质

有机溶剂残留: .....符合规定

**运输条件:** 湿冰运输 (按季节)

**产品用途:** 科研试剂, 广泛应用于分子生物学、细胞生物学、药理学等科研方面, 严禁用于人体。

### 生物活性:

靶点&IC <sub>50</sub>	hM4Di	hM3Dq
	4.2 nM(Ki)	6.3 nM(Ki)
体外研究	Designer Receptors Exclusively Activated by Designer Drugs(DREADD)是一种用于远程操纵自由活动动物的神经元活动的化学遗传学方法。DREADD 包含突变的 G 蛋白偶联受体(GPCR), 这些受体对其内源性神经递质没有反应, 但对其他“惰性”外源性物质有反应。	
体内研究	Deschloroclozapine(0.3 mg/kg; i.m)会损害雄性恒河猴(5 至 6 岁, 体重 5.5-7.9 kg)的工作记忆功能。Deschloroclozapine(0.1 mg/kg; i.m)在体内有效激活 DREADD 受体并可逆地诱导猴子的行为影响。低剂量 Deschloroclozapine(1 或 3μg/kg)的全身递送可在几分钟内通过 hM3Dq 增强小鼠和猴子的神经元活性。肌内注射 Deschloroclozapine(100μg/kg)可逆地诱导在前额叶皮层表达 hM4Di 的猴子的空间工作记忆缺陷。	



**溶液配制:**

浓度	质量		1 mg	5 mg	10 mg
	体积				
1 mM			3.4202 mL	17.1010 mL	34.2021 mL
5 mM			0.6840 mL	3.4202 mL	6.8404 mL
10 mM			0.3420 mL	1.7101 mL	3.4202 mL

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

**参考文献:**

- [1] Maggs JL, Williams D, Pirmohamed M, Park BK. The metabolic formation of reactive intermediates from clozapine, a drug associated with agranulocytosis in man. *J Pharmacol Exp Ther.* 1995 Dec;275(3):1463-75.
- [2] Hu F, Morris PJ, Bonaventura J, Fan H, Mathews WB, Holt DP, Lam S, Boehm M, Dannals RF, Pomper MG, Michaelides M, Horti AG. 18F-labeled radiotracers for in vivo imaging of DREADD with positron emission tomography. *Eur J Med Chem.* 2021 Mar 5;213:113047.
- [3] Upright NA, Baxter MG. Effect of chemogenetic actuator drugs on prefrontal cortex-dependent working memory in nonhuman primates. *Neuropsychopharmacology.* 2020 Oct;45(11):1793-1798.
- [4] Nagai Y, Miyakawa N, Takuwa H, et al. Deschloroclozapine, a potent and selective chemogenetic actuator enables rapid neuronal and behavioral modulations in mice and monkeys. *Nat Neurosci.* 2020 Sep;23(9):1157-1167.

S241201

