

LY404039

产品信息

产品名称	产品编号	规格
LY404039	53433ES08	5 mg
	53433ES25	25 mg

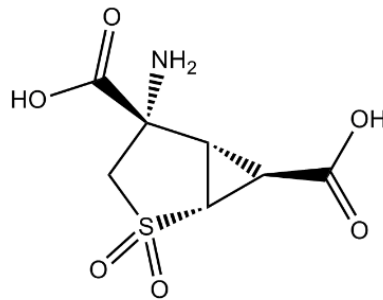
产品描述

LY404039 (pomaglumetad; LY-404039)是一种有效的、选择性的、具有口服活性的人类 mGlu2 和 mGlu3 受体以及大鼠神经元表达自身 mGlu2/3 受体的激动剂,其 K_i 值分别为 149 nM、92 nM 和 88 nM。LY404039 抑制 5-HT 诱导的兴奋性突触后电流 (EPSCs) ($EC_{50}=82.3$ nM)。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	pomaglumetad
中文名称 (Chinese Name)	Glu2 和 mGlu3 受体激动剂
靶点 (Target)	mGlu2 Receptor; hmGluR3
通路 (Pathway)	GPCR/G Protein--mGluR
CAS 号 (CAS NO.)	635318-11-5
分子式 (Formula)	$C_7H_9NO_6S$
分子量 (Molecular Weight)	235.21
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20°C , 有效期 3 年。建议分装后 -20°C 干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

LY404039 是一种强效激动剂，在大鼠神经元中表达天然 mGlu2/3 受体 ($K_i=88$ nM)。电生理学研究表明，LY404039 抑制纹状体中电诱发的兴奋活性，以及血清素诱导的前额叶皮层中的 L-谷氨酸释放。LY404039 抑制 5-HT 诱导的兴奋性突触后电流 (EPSCs) ($EC_{50}=82.3$ nM)，在 $1 \mu\text{M}$ 时接近最大抑制值 85.6%。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

LY404039 (1, 3, 10 mg/kg; 口服) 处理禁食大鼠，暴露量随剂量成比例增加。LY404039 (10 mg/kg; 口服) 的实验大鼠的 C_{max} 为 1528.5 ng/mL， T_{max} 为 2 小时。^[1]

参考文献

[1] Rorick-Kehn LM, et al. Pharmacological and pharmacokinetic properties of a structurally novel, potent, and selective metabotropic glutamate 2/3 receptor agonist: in vitro characterization of agonist (-) [3.1.0]-hexane-4,6-dicarboxylic acid (LY404039) -(1R,4S,5S,6S)-4-amino-2-sulfonylbicyclo J Pharmacol Exp Ther. 2007 Apr;321(1):308-17.