

产品名称：**2-甲基-6-(苯乙炔)吡啶盐酸盐**

产品别名：**MPEP**

生物活性:					
Description	MPEP 是一种选择性 mGlu5 受体拮抗剂, IC50 为 36 nM, 对 mGlu1b/2/3/4a/7b/8a/6 受体几乎没有作用活性。				
IC50 & Target	mGluR5 [1]				
	36 nM				
In Vitro	直到 100 μM 浓度 MPEP 对 CHO-K1 细胞中表达的重组人源 mGlu1b 受体以及 L(tk-)细胞中内源表达的嘌呤受体都没有明显的激动或拮抗活性。此外, MPEP 在 cAMP 积聚以及 [35S]-GTP γ S 与重组人源 II 型和 II 型代谢型谷氨酸受体 (人源 mGlu2, -3, -4a, -6, -7b, -8a) 和 人源 NMDA (NMDAR1A/2A, -1A/2B), 大鼠 AMPA (GluR3), 人源红藻氨酸 (GluR6) 受体亚型的结合过程中都没有明显的激动或拮抗活性。在新生大鼠海马, 纹状体以及大脑皮层但不包括小脑在内的切片中, MPEP 抑制 DHPG 刺激的 PI 水解, IC50 分别为 8.0 nM, 20.5 nM 和 17.9 nM [1]。MPEP 在一种重组表达系统中正向调节 hmGluR4, 这一效果完全依赖与 orthosteric 拮抗剂 L-AP4 的激活[3]。				
In Vivo	当微电泳给予应用于大鼠大脑时, MPEP 会降低 DHPG 诱导的刺激但对 AMPA 诱导的刺激没有影响。静脉注射 MPEP 会很快抑制 DHPG 诱导的刺激, 这种抑制作用具有剂量依赖特性, 但对 AMPA 诱导的刺激没有影响。在弗氏完全佐剂和松节油炎性痛模型中口服 MPEP 同样 表现出很好的抗痛觉过敏活性[1]。在大鼠冲突饮水和高架十字迷宫试验以及小鼠四平台试验中 MPEP (1-30 mg/kg) 诱导产生抗焦虑样的效果。MPEP (1-20 mg/kg)缩短了小鼠悬尾实验中不动时间但对行为绝望测试中的大鼠没有影响。MPEP 对自主活动以及运动协调性没有影响 [2]。MPEP 明显减少 fmr1 而不是野生型的中心区域进入次数和持续时间。在旷场试验中, MPEP 减少 fmr1tm1Cgr 的中心区域行为, 以致跟野生型无法区别。在测试的四组中, 10 mg/kg 和 30 mg/kg MPEP 显著减少其中三组总的自主活动[4]。				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : 39 mg/mL (201.82 mM) Ethanol: 39 mg/mL (201.82 mM) Water: Insoluble				
		<div>Solvent Mass Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	5.1749 mL	25.8746 mL	51.7491 mL
	Stock Solutions	5 mM	1.0350 mL	5.1749 mL	10.3498 mL
		10 mM	0.5175 mL	2.5875 mL	5.1749 mL
		50 mM	0.1035 mL	0.5175 mL	1.0350 mL
	<p><i>*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。</i></p> <p>储备液的保存方式和期限 -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。-80℃ 储存时, 请在 6 个月内使用, -20℃ 储存时, 请在 1 个月内使用。</p>				
References	<p>[1] Gasparini F, et al. Neuropharmacology, 1999, 38(10), 1493-1503.</p> <p>[2] Tatarczyńska E, et al. Br J Pharmacol, 2001, 132(7), 1423-1430.</p> <p>[3] Mathiesen JM, et al. Br J Pharmacol, 2003, 138(6), 1026-1030.</p> <p>[4] Yan QJ, et al. Neuropharmacology, 2005, 49(7), 1053-1066.</p>				
实验参考:					

Animal Administration	<p>动物实验: [2]</p> <p>Animal Models: 雄性 Wistar 大鼠, 雄性 Albino Swiss 小鼠或 雄性 C57BL/6J 小鼠</p> <p>Formulation: 用 1% Tween 80 水溶液配制成悬浮液</p> <p>Dosages: ~30 mg/kg</p> <p>Administration: 测试前一小时腹腔注射或口服</p>
References	<p>[1] Gasparini F, et al. <i>Neuropharmacology</i>, 1999, 38(10), 1493-1503.</p> <p>[2] Tatarczyńska E, et al. <i>Br J Pharmacol</i>, 2001, 132(7), 1423-1430.</p> <p>[3] Mathiesen JM, et al. <i>Br J Pharmacol</i>, 2003, 138(6), 1026-1030.</p> <p>[4] Yan QJ, et al. <i>Neuropharmacology</i>, 2005, 49(7), 1053-1066.</p>



源叶生物