

LY404039 ; LY-404039

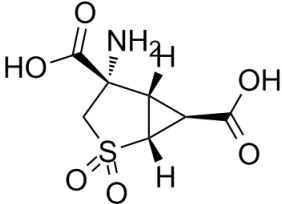
产品编号 : MB4086

质量标准 : >98% , mGlu2/mGlu3 受体激动剂

包装规格 : 5MG;25MG ; 50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C7H9NO6S	结 构 式	
分子量	235.22		
CAS No.	635318-11-5		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 3.84 mg/mL (16.33 mM; Need ultrasonic and warming)		
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 : LY404039 是 mGluR1 和 mGluR2 的抑制剂, 还能抑制多巴胺受体.

别名 : 2-Thiabicyclo[3.1.0]hexane-4,6-dicarboxylic acid, 4-amino-, 2,2-dioxide, (1R,4S,5S,6S)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至灰色固体

溶解性 :DMSO : 3.84 mg/mL (16.33 mM; Need ultrasonic and warming)

含量 :>98%

储存条件 : -20°C , 避光防潮密闭干燥

生物活性

LY4039 是 mGluR1(K_i=149nM)和 mGluR2(K_i=92nM)的抑制剂, 对多巴胺受体也有抑制作用。IC₅₀ 值 : 149nM(K_i for mGlu2) ; 92nM(K_i for mGlu3)靶点 : mGluR1 ; mGluR2 代谢型谷氨酸(mGlu)受体已被证明介导许多行为, 包括情绪和应激反应, 这在临床前和临床研究中已得到证实。

体外研究 : 与 LY354740 相似, LY4039 在重组人 mGlu2 和 mGlu3 受体(分别 K_i=149 和 92)以及表达天然 mGlu2/3 受体(K_i=88)的大鼠神经元中是纳米级强效激动剂。LY4039 对 mGlu2/3 受体具有高度选择性, 相对于离子型谷氨酸受体、谷氨酸转运体和已知抗焦虑和抗精神病药物靶向的其他受体, LY4039 对这些受体表现出超过 100 倍的选择性。

体内研究 : LY404039 能减弱苯丙胺和苯环吡引起的高运动 (分别为 3-30 和 10mg/kg) 。LY4039(3-10mg/kg)抑制条件回避反应。LY4039 还能减少大鼠的恐惧增强性惊吓 (3-30 微克/千克) 和小鼠的大

理石掩埋 (3-10 毫克/千克)，表明有类似焦虑的作用。重要的是，LY404039 没有产生镇静效果或运动损伤，如旋转臂性能和在条件回避任务中缺乏逃逸失败所测量的(剂量分别高达 30 和 10mg/kg)。LY4039 (10mg/kg) 还能够增加前额皮质的多巴胺和 5-羟色胺的释放/周转。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3677	ADX-47273
MB4087	MPEP
MB4088	VU 0361737

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。LY404039 是 mGluR1 和 mGluR2 的抑制剂，还能抑制多巴胺受体. 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置：

体 浓度	DMSO 质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	4.2515 mL	21.2576 mL	42.5152 mL
5 mM	0.8503 mL	4.2515 mL	8.5030 mL
10 mM	0.4252 mL	2.1258 mL	4.2515 mL
50 mM	-	-	-

【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。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，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。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。