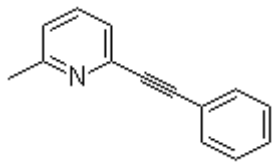
MPEP

产品编号：MB4087
质量标准：>98%,HCl
包装规格：10MG;50MG
产品形式：powder

基本信息

分子式	C14H11N	结构式	
分子量	229.7		
CAS No.	96206-92-7		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：39 mg/mL (201.82 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol：39 mg/mL (201.82 mM)		
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：MPEP 是 mGlu5 受体非竞争性拮抗剂，IC50 为 36 nM，还是 mGlu4 受体的正向变构调节剂。

别名：6-Methyl-2-(phenylethynyl)pyridine；MPEP

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO：39 mg/mL (201.82 mM)；Water Insoluble；Ethanol：39 mg/mL (201.82 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	MPEP 是选择性 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。
靶点	mGluR5
IC50	36 nM
体外研究	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]-GTPγS 与重组人源 II 型和 III 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。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。
体内研究	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。在大鼠冲突饮水和高架十字迷宫试验以及小鼠四平皿试验中 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。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。
特征	MPEP 对其它 I/II/III 型代谢型谷氨酸受体没有作用

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)

MB3798	NMDA (N-甲基-D-天门冬氨酸)
MB2930	DNQX
MB2932	CNQX
MB2934	NBQX
MB2935	D-AP5

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。MPEP 在 mGlu5 受体亚型(IC50=36nM)上是强效和高选择性的非竞争性拮抗剂，在 mGlu4 受体上是正的变构调节剂。在体内全身给药后 mGluR5 中枢活动。逆转发炎大鼠后肢机械性痛觉过敏。本品适用于相关科研领域实验。

储液配置

体积 / 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	5.1749 mL	25.8746 mL	51.7491 mL
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

经典实验操作（仅供参考）

动物实验：	**Animal Models:** 雄性 Wistar 大鼠, 雄性 Albino Swiss 小鼠或 雄性 C57BL/6J 小鼠 **Formulation:** 用 1% Tween 80 水溶液配制成悬浮液 **Dosages:** ~30 mg/kg **Administration:** 测试前一小时腹腔注射或口服

【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，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，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。