



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **Methoxy-PEPy**
产品别名: **Methoxy-PEPy**

生物活性:					
Description	Methoxy-PEPy is a potent and highly selective mGlu5 receptor antagonist with IC50 of 1 nM. IC50 value: 1 nM [1] Target: mGlu5R inhibitor Administration of [3H]methoxy-PEPy (50 microCi/kg i.v.) to mGlu5 receptor-deficient mice revealed binding at background levels in forebrain, whereas wild-type mice exhibited 14-fold higher binding in forebrain relative to cerebellum [2]. The calcium transients stimulated by these agonists were potently inhibited by reference allosteric mGlu5 antagonists - 2-methyl-6-(phenylethynyl)pyridine (MPEP), 3-[(2-methyl-1,3-thiazol-4-yl)ethynyl]pyridine (MTEP) and 3-methoxy-5-(pyridine-2-ylethynyl)pyridine (methoxy-PEPy) (IC(50) ranges: 0.8-66 nM) [3].				
Solvent&Solubility	In Vitro:				
	DMSO : 100 mg/mL (475.67 mM; Need ultrasonic)				
		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	4.7567 mL	23.7835 mL	47.5670 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.9513 mL	4.7567 mL	9.5134 mL
		10 mM	0.4757 mL	2.3783 mL	4.7567 mL
	*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。				
	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。				
	In Vivo:				
	请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：				
——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶					
1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline					
Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (11.89 mM); Clear solution					
此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (11.89 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。					
以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀					
向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。					
2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)					
Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (11.89 mM); Clear solution					
此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (11.89 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。					
以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水中，混合均匀。					
3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil					



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (11.89 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (11.89 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. Cosford ND, et al. [3H]-methoxymethyl-MTEP and [3H]-methoxy-PEPy: potent and selective radioligands for the metabotropic glutamate subtype 5 (mGlu5) receptor. <i>Bioorg Med Chem Lett</i>. 2003 Feb 10;13(3):351-4. [2]. Anderson JJ, et al. In vivo receptor occupancy of mGlu5 receptor antagonists using the novel radioligand [3H]3-methoxy-5-(pyridin-2-ylethynyl)pyridine. <i>Eur J Pharmacol</i>. 2003 Jul 18;473(1):35-40. [3]. Salisbury BG, et al. Inducible expression and pharmacological characterization of the mouse metabotropic glutamate 5b receptor. <i>Eur J Pharmacol</i>. 2008 Jan 28;579(1-3):34-9.

源叶生物