

## CTEP

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
CTEP	53960ES08	5 mg
	53960ES10	10 mg

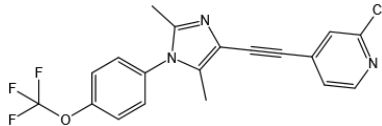
### 产品描述

CTEP (RO4956371, RO 4956371, mGluR5 inhibitor)是可口服的 mGlu5 受体选择性变构调节剂, IC<sub>50</sub> 为 2.2 nM, 具有反向激动剂的活性。代谢型谷氨酸受体 5 (mGlu5 Receptor)是一种谷氨酸激活的 CG 类蛋白偶联受体, 在中枢神经系统中广泛表达, 并作为一系列适应症的药物靶点进行临床研究, 包括抑郁症、帕金森病和脆性 X 综合征。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	CTEP, RO4956371, RO 4956371, mGluR5 inhibitor
靶点 (Target)	mGlu5 Receptor
通路 (Pathway)	GPCR/G Protein--mGluR
CAS 号 (CAS NO.)	871362-31-1
分子式 (Formula)	C <sub>19</sub> H <sub>13</sub> ClF <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O
分子量 (Molecular Weight)	391.77
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥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-25~-15°C, 有效期 3 年。建议分装后-25~-15°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)

在稳定表达人源 mGlu5 的 HEK293 细胞中, CTEP 抑制 quisqualate 诱导的 Ca<sup>2+</sup> 调动, IC<sub>50</sub> 为 11.4 nM, 还抑制 [<sup>3</sup>H]IP 积

累, IC<sub>50</sub> 为 6.4 nM。<sup>[1]</sup>

## (二) 动物实验 (体内实验)

在剂量为 0.1 mg/kg 和 0.3 mg/kg 时, CTEP 对治疗小鼠的焦虑有显著的效果; 0.3 mg/kg 和 1.0 mg/kg 剂量的 CTEP 对大鼠进行 Vogel 饮水冲突测试, 大鼠饮水次数显著增加, 而在低剂量时没有效果。<sup>[1]</sup> 在 Fmr1 敲除的小鼠中, 口服 CTEP (2 mg/kg) 能纠正过高的海马长时程抑制效应, 过多的蛋白表达以及听源性癫痫的发作。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

[1] Lindemann L, et al. CTEP: a novel, potent, long-acting, and orally bioavailable metabotropic glutamate receptor 5 inhibitor. *J Pharmacol Exp Ther*. 2011 Nov;339(2):474-86.

[2] Michalon A, et al. Chronic pharmacological mGlu5 inhibition corrects fragile X in adult mice. *Neuron*. 2012 Apr 12;74(1):49-56.