

VU 0361737

产品信息

产品名称	产品编号	规格
VU 0361737	53965ES08	5 mg
	53935ES25	25 mg

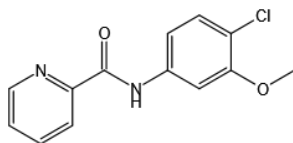
产品描述

VU 0361737 (VU0361737)是 mGlu4 受体(mGluR4)选择性正变构调节剂, 作用于人 mGlu4 受体的 EC₅₀ 为 0.24 μM, 可渗入中枢神经系统, 具有神经保护作用, 对 mGluR1/2/3/6/7 无明显作用, 对 mGluR5 和 mGluR8 显现出较弱的活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	VU 0361737, VU0361737
靶点 (Target)	mGlu4 receptor
通路 (Pathway)	GPCR/G Protein--mGluR
CAS 号 (CAS NO.)	1161205-04-4
分子式 (Formula)	C ₁₃ H ₁₁ ClN ₂ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	262.69
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)

VU0361737 (1-10 μM)部分减弱了 Staurosporine 和 Doxorubicin 诱发的人神经母细胞瘤 SH-SY5Y 细胞死亡。^[3]

(二) 动物实验 (体内实验)

在 Sprague-Dawley 大鼠中，腹膜内注射 VU0361737 (10 mg/kg)，血浆清除率高(894 mL/min/kg)，终末消除半衰期：大鼠 1.9 小时。^[1]

参考文献

- [1] Engers DW, et al. Synthesis and evaluation of a series of heterobiaryl amides that are centrally penetrant metabotropic glutamate receptor 4 (mGluR4) positive allosteric modulators (PAMs). *J Med Chem.* 2009 Jul 23;52(14):4115-8.
- [2] Engers DW, et al. Discovery, synthesis, and structure-activity relationship development of a series of N-(4-acetamido)phenylpicolinamides as positive allosteric modulators of metabotropic glutamate receptor 4 (mGlu(4)) with CNS exposure in rats. *J Med Chem.* 2011 Feb 24;54(4):1106-10.
- [3] Jantas D, et al. Neuroprotective effects of mGluR II and III activators against staurosporine- and doxorubicin-induced cellular injury in SH-SY5Y cells: New evidence for a mechanism involving inhibition of AIF translocation. *Neurochem Int.* 2015 Sep;88:124-37.