

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	L10028
产品名称:	LY 344864

产品简介:

一种选择性的、具有口服活性的 5-HT_{1F} receptor 激动剂, K_i 为 6 nM。LY 344864 是一种完全激动剂, 产生的效果与血清素本身的量级相似。LY 344864 在一定程度上可以通过血脑屏障。

靶点:	human 5-HT _{1F} Receptor	5-HT _{1F} 6-Receptor	Human5-HT _{1A} Receptor	human5-HT _{1B} Receptor
	0.006 μM (K _i)		0.530 μM (K _i)	0.549 μM (K _i)
	human 5-HT _{1D} Receptor	human 5-HT _{1E} Receptor	human5-HT _{2B} Receptor	Human5-HT _{2A} Receptor
	0.575 μM (K _i)	1.415 μM (K _i)	1.695 μM (K _i)	3.499 μM (K _i)
	Human 5-HT _{3A} Receptor	Human 5-HT ₇ Receptor	rat α 2-adrenergic receptor	rat α 2-adrenergic receptor
	3.935 mM (K _i)	4.851 μM (K _i)	3.69 μM (K _i)	5.06 μM (K _i)

体外研究:

LY 344864 与人类 5-HT_{1F}、5-HT_{1A}、5-HT_{1B}、5-HT_{1D}、5-HT_{1E}、5-HT_{3A}、5-HT_{2B}、5-HT_{2C}、5-HT₇ 受体, 以及大鼠 α 1-肾上腺素能和 α 2-肾上腺素能受体结合, 其 K_i 值分别为 0.006、0.530、0.549、0.575、1.415、3.935、1.695、3.499、4.851、5.06 和 3.69 μM。

LY 344864 是一种线粒体生物发生的诱导剂。

体内研究:

LY 344864 (0-10 ng/kg; 口服或静脉注射; 单次) 在大鼠偏头痛疼痛模型中可抑制神经源性硬脑膜炎。

LY 344864 (1 mg/kg; 静脉注射; 单次) 在大鼠中能在一定程度上穿过血脑屏障。

LY 344864 (2 mg/kg; 腹腔注射; 每天一次, 持续 14 天) 在帕金森病小鼠模型中可减轻多巴胺能神经元的丢失并改善行为学终点。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

溶于水 (10 mg/mL) 和 DMSO

浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	2.8456 mL	14.2280 mL	28.4560 mL
5 mM	0.5691 mL	2.8456 mL	5.6912 mL
10 mM	0.2846 mL	1.4228 mL	2.8456 mL

储备液的保存方式: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。

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。



三、动物实验	
Animal Model:	Male Wistar rats, migraine pain model
Dosage:	1-10 ng/kg (oral), 0.3-2 ng/kg (intravenous)
Administration:	Oral, 75 minutes before trigeminal stimulation or intravenous, 10 minutes before trigeminal stimulation
Result:	When given intravenously 10 minutes before stimulation, inhibited inflammation with an ID50 (median infective dose) of 0.6 ng/kg. When administered orally 75 minutes before trigeminal stimulation, an ID50 of 1.2 ng/kg was obtained.

Animal Model:	Male C57BL/6 mice, Parkinson' s disease model
Dosage:	2 mg/kg
Administration:	Intraperitoneal injection, daily for 14d beginning 7d post-lesion.
Result:	Attenuated TH-ir loss in the striatum and substantia nigra compared to vehicle-treated lesioned animals, also increased locomotor activity in 6-hydroxydopamine lesioned mice, while vehicle treatment had no effect.

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、以上信息仅做参考交流之用。

储存: -20℃