

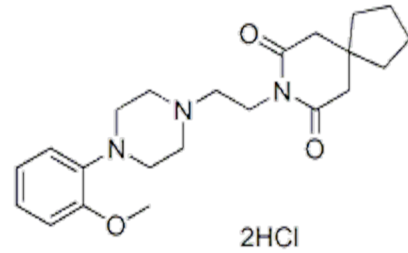
## BMY7378 (5-HT Receptor拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD9540-10mM	BMY7378 (5-HT Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD9540-5mg	BMY7378 (5-HT Receptor拮抗剂)	5mg
SD9540-25mg	BMY7378 (5-HT Receptor拮抗剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	8-[2-[4-(2-methoxyphenyl)piperazin-1-yl]ethyl]-8-azaspiro[4.5]decane-7,9-dione;dihydrochloride
简称	BMY7378
别名	BMY 7378, BMY-7378, BMY 7378 dihydrochloride
中文名	N/A
化学式	C <sub>22</sub> H <sub>31</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> ·2HCl
分子量	458.42
CAS号	21102-95-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water 92mg/ml; DMSO 92mg/ml; Ethanol 20mg/ml
溶液配制	5mg加入1.09ml DMSO, 或每4.58mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD9540-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	BMY 7378是一种多靶点抑制剂, 作用于α <sub>2</sub> C-adrenoceptor和α <sub>1</sub> D-adrenoceptor, pKi分别为6.54和8.2, 且为混合型5-HT <sub>1A</sub> 受体激动剂和拮抗剂, pKi为8.3。				
信号通路	Neuronal Signaling; GPCR & G Protein				
靶点	5-HT <sub>1A</sub>	α <sub>1</sub> D-adrenoceptor	Dopamine D2 receptor	α <sub>2</sub> C-adrenoceptor	5-HT <sub>1C</sub>
IC <sub>50</sub>	8.3(pIC <sub>50</sub> )	8.2(pKi)	7.4(pIC <sub>50</sub> )	6.54(pKi)	6.4(pIC <sub>50</sub> )
体外研究	BMY7378对α <sub>2</sub> C-肾上腺素受体的选择性比其他α <sub>2</sub> -肾上腺素受体高10倍, pKi为6.54。BMY 7378选择性作用于α <sub>1</sub> D-肾上腺素受体亚型(Pki: 仓鼠α <sub>1b</sub> -肾上腺素受体6.2, 人α <sub>1b</sub> -肾上腺素受体7.2; 牛α <sub>1c</sub> -肾上腺素受体6.1, 人α <sub>1c</sub> -肾上腺素受体6.6; 大鼠α <sub>1d</sub> -肾上腺素受体8.2, 人α <sub>1d</sub> -肾上腺素受体9.4)。BMY 7378在1nM到30nM浓度下在大鼠中缝背核中产生剂量依赖性抑制作用。				
体内研究	BMY 7378(pA <sub>2</sub> 为8.67)作用于去甲肾上腺素引起的大鼠主动脉收缩, 比yohimbine(pA <sub>2</sub> 为6.62)有效100倍左右。BMY 7378(pA <sub>2</sub> 为6.48)对人体隐静脉(α <sub>2</sub> C-肾上腺素受体)中去甲肾上腺素引起的收缩响应产生拮抗作用, 该作用比yohimbine(pA <sub>2</sub> 为7.56)低10倍。BMY 7378剂量依赖性(0.25-5mg/kg s.c.)降低大鼠体内8-OH-DPAT(0.75mg/kg s.c.)诱导的不可测水平的前爪踩踏和头部摇晃。在麻醉大鼠的腹侧海马体中, 通过在大鼠体内微量渗析检测, BMY 7378剂量依赖性显著减少5-HT释放。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	制备大鼠肾脏细胞膜和表达人重组α <sub>2</sub> C-肾上腺素受体的Sf9细胞的细胞膜。产生的微粒立即使用, 或储存在-20°C供以后使用。微粒在10体积(肾脏)或25体积(Sf9细胞)培育缓冲液中重新生成。在饱和实验中, 等份细胞膜悬浮液与不同浓度的 <sup>3</sup> H]-yohimbine(比活度: 81Ci/mmol)在25°C(大鼠肾脏: 0.5-30nM; Sf9细胞: 0.2-20nM; 大鼠颌下腺: 1.0-40nM; 孵育缓冲液: Tris-HCl 50mM, EDTA 5mM, pH 7.4)下进行培育。在竞争性研究中, <sup>3</sup> H]-yohimbine(5或10nM)与0.1nM-1mM的浓度以0.5对数单元增长的竞争性配体培育30分钟。非特异性结合在phentolamine(10M)存在下测定。 <sup>3</sup> H]-yohimbine的特异性结合是置换实验中使用的浓度下, 总结和量的70-90%。用冰预冷的培育缓冲液洗涤终止试验, 随后使用Brandel细胞采集器通过Whatman GF/C过滤器快速真空过滤。保留在过滤器上的放射性通过液体闪烁光谱法测定。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	大鼠
配制	无菌0.9%氯化钠溶液
剂量	0.25-5mg/kg
给药方式	单剂量皮下注射

➤ **参考文献:**

- 1.Cleary L, et al. Auton Autacoid Pharmacol, 2005, 25(4), 135-141.
- 2.Greuel JM, et al. Eur J Pharmacol, 1992, 211(2), 211-219.
- 3.Sharp T, et al. Eur J Pharmacol, 1990, 176(3), 331-40.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD9540-10mM	BMY7378 (5-HT Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD9540-5mg	BMY7378 (5-HT Receptor拮抗剂)	5mg
SD9540-25mg	BMY7378 (5-HT Receptor拮抗剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：

<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01