

Catalog Number: CM02367

产品信息

Catalog Number:
CM02367

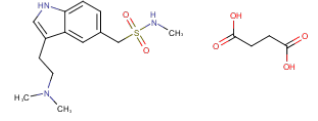
CAS号:
103628-48-4

分子式:
C₁₈H₂₇N₃O₆S

主要靶点:
5-HT Receptor

主要通路:
G蛋白偶联受体|神经科学

分子量:
413.49

溶解度:
H₂O:41.4 mg/mL (100 mM), DMSO:31 mg/mL (75 mM)


靶点活性

5-HT 1A Receptor:100 nM (Ki)|5-HT 1B Receptor:27 nM (Ki)|5-HT 1D Receptor:17 nM (Ki)

体外活性

通过代谢和肾清除,Sumatriptan被迅速清除,t_{1/2}为1-2h.在急性给药时,除了犬对高剂量用药耐受性不是特别好外,Sumatriptan很少产生不良药效.临床皮下注射Sumatriptan (100 mg/kg)明显减少三叉神经性疼痛大鼠模型的受伤和对侧中机械异常性疼痛样行为(峰效应分别为6.3克和4.4克).在中,Sumatriptan降低机械刺激后猫的三叉神经核尾侧I,II和C2中的Fos阳性细胞数(分别为6,13细胞和9细胞).在大鼠,兔和狗中,Sumatriptan的生物活性分别是37%,23%和58%.经动物颅血管中的5-HT1受体亚型介导,Sumatriptan选可择性收缩在偏头痛期间扩张和发炎的颅血管.

体内活性

Sumatriptan显著降低由电三叉神经刺激血浆蛋白引起的外渗.在电三叉神经节刺激的肥大细胞内硬脑膜和小静脉中,Sumatriptan减少毛细血管中的形态学变化.Sumatriptan对血清素受体 1A结合位点 (K_i=100 nM)的亲和力略低,对5HT (K_i=17 nM)和5HT受体1B结合位点 (K_i= 27 nM)亲和力最高.

描述

Sumatriptan succinate, a serotonin1 (5-HT1) receptor agonist, is used in the acute treatment of a migraine headache.

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 2 years