

Agomelatine ; 阿戈美拉汀 ; BIBR 953

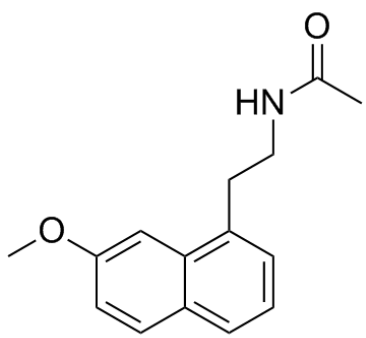
产品编号 : MB1990

质量标准 : >99% , II 晶型

包装规格 : 100MG ; 1G

产品形式 : 白色至类白色固体

基本信息

分子式	C ₁₅ H ₁₇ NO ₂	结 构 式	
分子量	243.3		
CAS No.	138112-76-2		
储存条件	-20℃ , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 48 mg/mL (197.28 mM) Ethanol 48 mg/mL (197.28 mM) Water Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介 : 阿戈美拉汀 Agomelatine 是人和猪的 5-HT_{2C} 受体竞争性拮抗剂, pK_i 分别为 6.2 和 6.4。

别名 : Acetamide, BIBR 953 , N-[2-(7-methoxy-1-naphthalenyl)ethyl]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO 48 mg/mL (197.28 mM) ; Ethanol 48 mg/mL (197.28 mM) ; Water Insoluble

纯度 :>99% , II 晶型

储存条件 : -20℃ , 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Agomelatine 是人类和猪血清素(5-HT _{2C})受体(pK _i 分别为 6.2 和 6.4)以及人类 5-HT _{2B} 受体(pK _i = 6.6)的竞争性拮抗剂。由于其 5-HT _{2C} 受体的拮抗作用, 被分类为去甲肾上腺素-多巴胺抑制剂 (NDDI)。血清素激活 5-HT _{2C} 受体抑制多巴胺和去甲肾上腺素的释放。5-HT _{2C} 拮抗可促进 DA 和 NE 的释放和额皮质多巴胺能和肾上腺素能通路的活性。Agomelatine 也是抗褪黑素受体的一种强效激动剂, 可用于抗抑郁领域的研究。
靶点	5-HT _{2C} ; 5-HT _{2B}
体外研究	在慢性应激电击的小鼠的海马中, Agomelatine 完全正常化压力影响的细胞生存并部分逆转降低的 doublecortin 表达。
体内研究	在转基因小鼠中, Agomelatine 有效扭转了强迫游泳试验, 以及在高架十字迷宫的行为改变。

Agomelatine 也显著加快了温度和活性的昼夜周期的调整,接下来是诱导的内容相移。在成年大鼠的腹侧海马 (VH) 中,这是情绪障碍相关的区域,Agomelatine 增强细胞增殖和神经发生。Agomelatine 增加成熟和未成熟神经元的比例,并提高颗粒细胞在成年大鼠的神经突增生,这表明成熟加速。Agomelatine 还激活多个细胞信号 (细胞外信号调节激酶 1/2, 蛋白激酶 B, 和糖原合酶激酶 3 β), 这些信号为抗抑郁药调控和参与增殖/存活的控制。在暴露于一种新型的环境的不熟悉的成对大鼠中,Agomelatine 增加参加社会活动的时间。在大鼠的腹侧齿状回中,Agomelatine 增加细胞增殖和神经发生,这个区域涉及情感响应,这与 Agomelatine 的抗抑郁抗焦虑性质是一致的。在大鼠的整个齿状回中,Agomelatine 增加了新生神经元的存活。

美仑相关产品推荐

MB0848	Vorapaxar
MB10062	[Cit5]-凝血酶受体激动肽-5
MB10260	[Phe1,Ser2]- 凝血酶受体激动剂肽-6
MB1368	凝血酶来源于牛血浆

用途及描述: 科研试剂,广泛应用于分子生物学,药理学等科研方面,严禁用于人体。Agomelatine 是人类和猪血清素(5-HT_{2C})受体(pKi 分别为 6.2 和 6.4)以及人类 5-HT_{2B} 受体(pKi = 6.6)的竞争性拮抗剂。Agomelatine 也是抗褪黑素受体的一种强效激动剂,这使它成为第一个 mel 受体类抗抑郁药。本品可用于抗抑郁相关领域的研究。

储液配置:

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	4.1102 mL	20.5508 mL	41.1015 mL
5 mM	0.8220 mL	4.1102 mL	8.2203 mL
10 mM	0.4110 mL	2.0551 mL	4.1102 mL
50 mM	0.0822 mL	0.4110 mL	0.8220 mL

【注意】

- 我司产品为非无菌包装,若用于细胞培养,请提前做预处理,除去热原细菌,否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息,我司不保证所提供信息的权威性,以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M ²)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。