

Ramelteon ; 雷美替胺

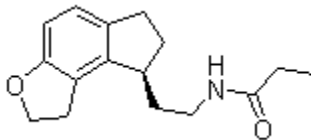
产品编号：MB1992

质量标准：>98%

包装规格：200MG;1G

产品形式：白色或类白色粉末

基本信息

分子式	C16H21NO2	结构式	
分子量	259.34		
CAS No.	196597-26-9		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 52 mg/mL (200.5 mM) Water <1.2 mg/ml Ethanol 52 mg/mL (200.5 mM)		
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：雷美替胺 Ramelteon 是高效选择性的 melatonin 受体激动剂，结合人 melatonin1 和 melatonin2 受体的 K_i 值分别为 14 和 112 pM。

别名：(S)-N-[2-(1,6,7,8-Tetrahydro-2H-indeno-[5,4-b]furan-8-yl)ethyl]propionamide, Ramelteon solution, TAK 375, TAK-375

物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色粉末

溶解性：.....DMSO 52 mg/mL (200.5 mM) ; Water <1.2 mg/ml ; Ethanol 52 mg/mL (200.5 mM)

熔点：.....114-116 °C

含量：.....>98%

密度：.....~1.1 g/cm³ (预测)

IC₅₀：.....大鼠：IC₅₀ = 20.8 pM

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Ramelteon 是一种新型的 Melatonin 受体激动剂，作用于人 MT1 和 MT2 受体及小鸡前脑 Melatonin 受体， K_i 值分别为 14 pM，112 pM 和 23.1 pM。		
特性	Ramelteon 是一种三环的合成的 Melatonin 类似物。		
靶点	MT1 receptor (Cell-free assay)	MT receptor (chicken) (Cell-free assay)	MT2 receptor (Cell-free assay)
	14 pM(Ki)	23.1 pM(Ki)	112 pM(Ki)
体外研究	Ramelteon 作用于 CHO 细胞，抑制 forskolin 刺激的 cAMP 产生，这种作用具有浓度依赖性，IC ₅₀ 为 21.2 pM。Ramelteon 高亲和力地作用于重组 MT1 和 MT2 受体，pK _i 分别为		

	10.05 和 9.70。Ramelteon 抑制非洲爪蟾的黑色素细胞色素颗粒聚集，pEC50 为 11.48。Ramelteon (1 nM) 不仅增加 MT1/MT2 小脑颗粒细胞的 ERK1/2 磷酸磷酸化，也增加只含一个褪黑激素受体的小脑颗粒细胞的 ERK1/2 磷酸磷酸化。4P-PDOT 作用于 MT1 KO 小脑颗粒细胞，阻止 Ramelteon (1 nM) 的刺激作用，而 Luzindole 作用于 MT2 KO 小脑颗粒细胞，降低 Ramelteon (1 nM) 的作用。
体内研究	Ramelteon 按 10 mg/kg 剂量腹腔注射给药大鼠，显著降低非快速眼动 (NREM) 睡眠潜伏期 (从注射到出现 NREM 睡眠的时间)。Ramelteon (10 mg/kg, 腹腔注射) 也短暂增加 NREM 睡眠时间，但 NREM 功率谱是不变的。Ramelteon 按 0.1 mg/kg 和 1 mg/kg 剂量口服给药大鼠，加速白天-黑夜周期节奏，但是不影响学习或记忆。Ramelteon 按 0.03 mg/kg 和 0.3 mg/kg 剂量口服给药自由活动的猴子，显著缩短了延迟睡眠，且增加总的睡眠时间，但不影响猴子的日常行为。

美仑相关产品推荐

MB25806	外消旋雷美替胺-d3
---------	------------

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。雷美替胺是一种强效、高度选择性褪黑激素受体激动剂，它作用于视交叉上核(亦被称为昼夜节律钟)上的褪黑激 MT1 和 MT2 受体。雷美替胺对 MT1 受体的亲和力、选择性和效力比褪黑激素大，而 MT1 受体又被认为是人体睡眠管理的一个组成部分。与苯二氮类药物不同，雷美替胺不会减少人体眼速动期 (REM) 睡眠，是首个无滥用和依赖性的失眠处方治疗药。其最常见的副作用是头痛(19.4%)、疲劳(9.4%)、嗜睡(7.9%)等，总发生率与安慰剂(18.3%、2.3%、1.5%)相似。不损害次日认知活动，无撤药症状、反跳失眠或滥用趋势。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.8559 mL	19.2797 mL	38.5594 mL
5 mM	0.7712 mL	3.8559 mL	7.7119 mL
10 mM	0.3856 mL	1.9280 mL	3.8559 mL
50 mM	0.0771 mL	0.3856 mL	0.7712 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	编码人 MT1 基因的 cDNA 被导入 CHO 细胞。细胞收集在 Ca ²⁺ 和 Mg ²⁺ 游离 Hanks 的平衡盐溶液中，含有 5 毫米 EDTA 并通过离心收集。细胞在冰冷的 50mM Tris-HCl 缓冲液中均质，洗涤两次，造粒，在 -30°C 下保存，直到进行结合试验。将试验化合物和 40pM 2-[125I]褪黑素以 1mL 的总体积与解冻的匀浆混合，在 25°C 下孵育 150 分钟，加入 3mL 的冰冷缓冲液，然后用 Whatman GF/B 真空过滤，终止反应。Y 由 G 计数器计数。
动物实验	大鼠： Ramelteon 溶解于 DMSO 中，浓度为 200 mg/ml，在生理盐水中立即稀释 100 倍。另一组六只植入大鼠给予车辆或雷米尔泰 (10 毫克/公斤 I.P.)。EEG 和 EMG 在注射前记录 1 小时，然后再注射 3.5 小时。所有治疗均在 24:00 小时 (接近 L:D 周期的黑暗阶段的中点) 给予，在同一动物中分离注射至少 72 小时。每只大鼠都接受完全随机、平衡的交叉设计，以减少研究中需要的动物数量。

【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(M2)	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。