

Desvenlafaxine (O-Desmethylvenlafaxine)

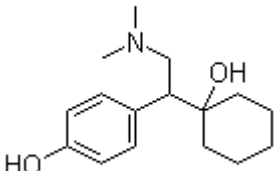
产品编号: MB1997

质量标准: >98%

包装规格: 5MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C16H25NO2	结 构 式	
分子量	263.37		
CAS No.	93413-62-8		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥, 2年		
溶解性 (25℃)	DMSO : 50 mg/mL (189.84 mM; Need ultrasonic) Ethanol: 3 mg/mL (11.39 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: Desvenlafaxine 是 5-羟色胺 (5-HT) 和去甲肾上腺素 (NE) 重吸收抑制剂, Ki 为 40.2 nM 和 558.4 nM。

别名: O-去甲文拉法辛(D,L); O-Desmethylvenlafaxine; Phenol, 4-[2-(dimethylamino)-1-(1-hydroxycyclohexyl)ethyl]-

物理性状及指标:

外观:白色结晶性粉末

熔点:208-213℃

溶解性:DMSO : 50 mg/mL (189.84 mM; Need ultrasonic)

密度:~1.1 g/cm³ (预测)

含量:>98%

IC50:α-1a 肾上腺素受体: IC50 = 60 nM (大鼠); 血清素转运体: IC50 = 180 nM (大鼠);

.....去甲肾上腺素转运体: IC50 = 1.16 μM (大鼠)

生物活性

Desvenlafaxine 是 5-羟色胺 (5-HT) 和去甲肾上腺素 (NE) 重摄取抑制剂, Ki 分别为 40.2 nM 和 558.4 nM。

目标: SSRI Desvenlafaxine 是 5-羟色胺-去甲肾上腺素再摄取抑制剂, 是抗抑郁药文拉法辛的活性代谢产物。

与文拉法辛类似, 去甲文拉法辛抑制 5-羟色胺和去甲肾上腺素的神经元摄取。Desvenlafaxine 对多巴胺 (DA) 转运蛋白显示弱的结合亲和力(在 100μM 时抑制 62%)。去甲文拉法辛抑制 hSERT 或 hNET 的 [3H] 5-HT 或 [3H] NE 吸收, IC50 分别为 47.3 和 531.3 nM。Desvenlafaxine 迅速穿透雄性大鼠的大脑和下丘脑。与雄性大鼠下丘脑的基线相比, 去甲文拉法辛显着提高了细胞外 NE 水平, 但使用微透析对地水平 DA 的水平没有影响。

Desvenlafaxine 具有抑制 CYP2D6 的潜能, 这可能导致通过该途径代谢的药物浓度增加。地斯拉法辛也可能诱导 CYP3A4, 这可能会影响通过该酶代谢的药物的代谢。Desvenlafaxine 在 100 至 600 mg / day 的剂量范围内显示出线性且与剂量成比例的药代动力学单剂量分布。口服制剂的绝对生物利用度为 80.5%。

Desvenlafaxine 具有抑制 CYP2D6 的潜能, 这可能导致通过该途径代谢的药物浓度增加。地斯拉法辛也可能诱导 CYP3A4, 这可能会影响通过该酶代谢的药物的代谢。Desvenlafaxine 在 100 至 600 mg / day 的剂量范围内显示出线性且与剂量成比例的药代动力学单剂量分布。口服制剂的绝对生物利用度为 80.5%。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB1489	Paroxetine HCl
MB1555	Fluoxetine Hydrochloride
MB1588	Mirtazapine

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。O-去甲基文拉法辛是 5-HT、NE 再摄取的强抑制剂, 是多巴胺的弱抑制剂。体外试验未发现 O-去甲基文拉法辛对 M 胆碱受体、H1 组胺受体、 α 1-肾上腺素能受体有明显的亲和力。O-去甲基文拉法辛也无 MAO 抑制活性。

储液配置及储存: 50 mg/mL (189.84 mM; Need ultrasonic); 如溶解困难, 可以通过快速搅拌, 超声或温和加热 (在 45-60°C 下水浴)。液体稳定性报道的很少, 建议现配现用, 如需储存, 建议: -20°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.7968 mL	18.9840 mL	37.9680 mL
5 mM	0.7594 mL	3.7968 mL	7.5936 mL
10 mM	0.3797 mL	1.8984 mL	3.7968 mL
50mM	-	-	-

【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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。