Tasimelteon；BMS214778；他司美琼

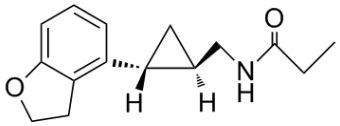
产品编号：MB3307

质量标准：>98%,MT1 和 MT2 受体激动剂

包装规格：10MG;50MG;200MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C15H19NO2	结构式	
分子量	245.32		
CAS No.	609799-22-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 49 mg/mL (199.73 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：他司美琼 Tasimelteon 是褪黑素 MT1 和 MT2 受体激动剂。

别名：BMS-214778; VEC-162; Propanamide,

N-[[(1R,2R)-2-(2,3-dihydro-4-benzofuranyl)cyclopropyl]methyl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO 49 mg/mL (199.73 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Tasimelteon 是一种选择性双褪黑素受体(MT1 /是)受体激动剂是受体的亲和力大 2.1 - -4.4 倍认为调节昼夜节律移相(Ki = 0.0692 nM 和 Ki = 0.17 nM NIH-3T3 CHOeK1 细胞,分别),比 MT1 受体(Ki = 0.304 nM 和 Ki = 0.35 nM),分别)。
靶点	MT2 receptor: 9.8(pKi); MT1 receptor: 9.45(pKi)
体外研究	Tasimelteon 是一种昼夜节律调节器，通过与褪黑素 MT1 和 MT2 受体结合，重置下丘脑视交叉上核的主时钟，使其成为双褪黑素受体激动剂。tasimelteon 对 MT2 受体的亲和力是 MT1 受体的 4 倍。
体内研究	在大鼠和猴子中，tasimelteon 的半衰期约为 2 小时，比褪黑素的半衰期长。Tasimelteon 的平均绝对生物利用度约为 38.3%。对 tasimelteon 的代谢产物进行 IV 处理后，口服-静脉接触比较高，代谢物-父母比降低，这表明尽管 tasimelteon 受到了第一次代谢的影响，但其代谢的相当一部分发生在术后，而不是在术前。口服和静脉 tasimelteon 均有良好的耐受性。

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。Tasimelteon 是一种褪黑素 MT1 和 MT2 受体激动剂。褪黑素受体 Tasimelteon 是一种新型的昼夜节律调节器，是 FDA 或欧洲药物管理局(EMA)批准的第一种治疗非 24 小时睡眠-觉醒障碍(Non-24)的产品。Tasimelteon 是一种强有力的特异性褪黑激素(MT1 和 MT2)受体激动剂，对 MT2 受体的亲和力是后者的 2 - 4 倍。

储液配置：

体积 DMSO 质量 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	4.0763 mL	20.3815 mL	40.7631 mL
5 mM	0.8153 mL	4.0763 mL	8.1526 mL
10 mM	0.4076 mL	2.0382 mL	4.0763 mL
50 mM	0.0815 mL	0.4076 mL	0.8153 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(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。