

Vortioxetine hydrobromide; 沃替西汀氢溴酸盐(LuAA21004)

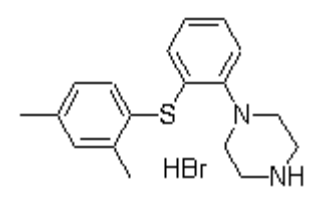
产品编号: MB4782

质量标准: >99%,a 晶型,BR

包装规格: 100MG;1G

产品形式: solid

基本信息

分子式	C18H22N2S.HBr	结 构 式	
分子量	379.36		
CAS No.	960203-27-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 76 mg/mL (200.33 mM) Water: Insoluble Ethanol: 17 mg/mL (44.81 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: Vortioxetine hydrobromide 是 5-HT_{1A}, 5-HT_{1B}, 5-HT_{3A}, 5-HT₇ 受体 和 5-羟色胺转运体 (SERT) 的抑制剂。

别名: Lu AA21004 hydrobromide; 盐酸沃替西汀; Piperazine, 1-[2-[(2,4-dimethylphenyl)thio]phenyl]-, hydrobromide (1:1)

物理性状及指标:

外观:淡黄色至黄色固体

溶解性:DMSO: 76 mg/mL (200.33 mM); Water: Insoluble; Ethanol: 17 mg/mL (44.81 mM)

含量:>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Vortioxetine (Lu AA21004) HBr 是一种 5-羟色胺抑制剂, 抑制 5-HT _{1A} , 5-HT _{1B} , 5-HT _{3A} , 5-HT ₇ 受体和 SERT, IC ₅₀ 分别为 15 nM, 33 nM, 3.7 nM, 19 nM 和 1.6 nM。				
特性	多模式的抗抑郁药剂				
靶点	SERT	5-HT _{3A}	5-HT _{1A}	5-HT ₇	5-HT _{1B}
	1.6 nM(Ki)	3.7 nM(Ki)	15 nM(Ki)	19 nM(Ki)	33 nM(Ki)
体外研究	Lu-AA21004 抑制重组人类 CYP1A2, CYP2C9, CYP2D6 和 CYP3A4, IC ₅₀ 分别为 40 μM, 39 μM, 9.8 μM 和 10 μM。Lu AA21004 是 h5-HT _{1B} 受体激动剂, EC ₅₀ 为 460 nM, 全细胞检测中内在活性为 22%。在体外全细胞 cAMP 检测中, Lu AA21004 结合到 r5-HT ₇ 受体上, Ki 为 200 nM, Lu AA21004 是 r5-HT ₇ 受体的一种功能性拮抗剂, IC ₅₀ 为 2μM。				
体内研究	Lu-AA21004 处理大鼠的肝脏清除力及口服生物有效性分别为 7.1(L/h)/kg 和 16%。 Lu-AA21004 按 2.5 mg/kg, 5 mg/kg, 或 10 mg/kg 剂量皮下注射到清醒大鼠腹侧的海马区,				

<p>增强细胞外 5-HT 的水平。Lu-AA21004 按 5 mg/kg 或 10 mg/kg 剂量处理内侧前额叶皮层 (mPFC) 3 天后, 显著提高 5-HT 的基础水平。Lu AA21004 影响大鼠的 Bezold-Jarisch 反射, 这种作用存在剂量依赖性, 抑制短暂的心动过缓, ED50 为 0.11 mg/kg。Lu AA21004 按 2.5-10.0 mg/kg 剂量皮下注射到大鼠的内侧前额叶皮层和腹侧海马区, 提高细胞外 5-HT, DA, 和 NA 的水平。Lu AA21004 按 5 mg/kg 剂量皮下注射到大鼠的腹侧海马区, 提高细胞外 5-HT 水平 (200%) Lu AA21004 (10 mg/kg) 显著降低大鼠的痛觉。Lu AA21004 按 5 和 10 mg/kg 剂量注射 20 分钟后, 提高 ACh 的水平, 分别提高到 224% 和 204%。</p>

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)

MB3671	SB742457
MB3795	VUF 10166
MB3737	WAY-100635 Maleate

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。Vortioxetine hydrobromide 是 5-HT_{1A}, 5-HT_{1B}, 5-HT_{3A}, 5-HT₇ 受体 和 5-羟色胺转运体 (SERT) 的抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6360 mL	13.1801 mL	26.3602 mL
5 mM	0.5272 mL	2.6360 mL	5.2720 mL
10 mM	0.2636 mL	1.3180 mL	2.6360 mL
50 mM	0.0527 mL	0.2636 mL	0.5272 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	<p>Animal Models: 大鼠 Formulation: 10%羟丙基-β-环糊精 Dosages: 10 mg/kg Administration: 皮下处理</p>
-------------	-------------------------------------------------------------------------------------------------------

【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。