

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	A12001
产品名称:	阿戈美拉汀

产品简介:

一种 T1 和 T2 受体的特异性激动剂。

Agoelatine (BAN, rINN; trade naes Valdoxan, elitor, Thyanax) is a elatnergic antidepressant developed by the pharaceutical copany Servier. It is areted for the treatent of ajor depressive disorder and has been reported to not produce discontinuation syndroe and have no sexual side effects copared to SSRIs, SNRIs and the older tricyclic antidepressants. Agoelatine ay also have positive effects on sleep. Agoelatine is a elatnergic agonist (T1 and T2 receptors) and 5-HT2C antagonist. Binding studies indicate that it has no effect on onoaime uptae and no affinity for α , β adrenergic, histainergic, cholinergic, dopainergic and benzodiazepine receptors.

靶点:	5-HT2C Receptor	5-HT2C Receptor	5-HT2C Receptor	hMT1
		6.4(pKi, native porcine)	6.2 (pKi, human)	0.1 nM (Ki, CHO Cells)
	hMT1	hMT2	hMT2	
	0.06 nM(Ki, HEK Cells)	0.12 nM (Ki, CHO Cells)	0.27 nM (Ki, HEK Cells)	

体外研究:

Agomelatine (S-20098) 作为 MT1 和 MT2 受体的完全激动剂, 对 CHO hMT1、CHO-hMT2 (hMT1 和 hMT2 受体在 CHO 中表达) 的 EC50 为 1.6 ± 0.4 , 0.10 ± 0.04 nM 或 HEK 细胞膜)。

阿戈美拉汀 (S-20098) 也与 h5-HT2B 受体 (6.6) 相互作用, 而阿戈美拉汀对天然(大鼠) /克隆的人类 5 表现出低亲和力-HT2A (<5.0)。

体内研究:

Agomelatine (25、50 或 75 mg/kg; ip) 在 Strychnine (75 mg/kg, ip) 或 Pilocarpine (400 mg/kg, ip) 诱导的小鼠癫痫发作模型中具有抗氧化活性。与对照组相比, 阿戈美拉汀剂量对戊四唑 (PTZ) 或印防己毒素 (PTX) 诱导的癫痫发作模型产生的氧化应激参数没有任何抗氧化作用。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验				
DMSO: 溶于 DMSO (≥ 100 mg/mL)				
浓度	质量	1mg	5mg	10mg
	溶液体积			
	1 mM			
	5 mM			
10 mM		0.4110 mL	2.0551 mL	4.1102 mL
储备液的保存方式: -80°C , 2 years; -20°C , 1 year.				
二: 体内实验				



1、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (10.28 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。

2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% (20% SBE- β -CD in Saline)

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (10.28 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。2 g SBE- β -CD (磺丁基醚 β -环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (10.28 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中，混合均匀。

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

注意事项：

1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存： -20℃

