

产品名称：阿莫伦特盐酸盐
产品别名：**Almorexant hydrochloride; ACT-078573 hydrochloride**

生物活性:					
Description	Almorexant hydrochloride (ACT 078573 hydrochloride) is a potent and competitive dual orexin 1 receptor(OX1)/orexin 2 receptor (OX2) antagonist with K _i values of 1.3 and 0.17 nM, respectively.				
IC ₅₀ & Target	IC50: 1.3/0.7 nM(OX1/OX2 receptor)				
Solvent&Solubility	<i>In Vitro:</i> DMSO : ≥ 46 mg/mL (83.79 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.				
	Preparing Stock Solutions	<div><div>Solvent</div><div>Mass</div><div>Concentration</div></div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.8214 mL	9.1071 mL	18.2143 mL
		5 mM	0.3643 mL	1.8214 mL	3.6429 mL
		10 mM	0.1821 mL	0.9107 mL	1.8214 mL
	<p>*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。</p> <p>储备液的保存方式和期限 -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。</p> <p><i>In Vivo:</i></p> <p>请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：</p> <p>——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶</p> <p>1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.55 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.55 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀，向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。</p> <p>2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.55 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.55 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。</p> <p>3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.55 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.55 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。</p> <p>以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。</p>				
	[1]. Malherbe P, et al. Biochemical and electrophysiological characterization of almorexant, a dual orexin 1				

References

- receptor (OX1)/orexin 2 receptor (OX2) antagonist: comparison with selective OX1 and OX2 antagonists. Mol Pharmacol. 2009 Sep;76(3):618-31.
- [2]. Borniger JC, et al. A Role for Hypocretin/Orexin in Metabolic and Sleep Abnormalities in a Mouse Model of Non-metastatic Breast Cancer. Cell Metab. 2018 Jul 3;28(1):118-129.e5.
- [3]. Sifferlen T, et al. Novel pyrazolo-tetrahydropyridines as potent orexin receptor antagonists. Bioorg Med Chem Lett. 2010 Mar 1;20(5):1539-42.
- [4]. Black SW, et al. Almorexant promotes sleep and exacerbates cataplexy in a murine model of narcolepsy. Sleep. 2013 Mar 1;36(3):325-36.
- [5]. Cruz HG, et al. Assessment of the abuse liability of a dual orexin receptor antagonist: a crossover study of almorexant and zolpidem in recreational drug users. CNS Drugs. 2014 Apr;28(4):361-72.



源叶生物