



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **Asenapine**
产品别名: 阿塞那平; **Org 5222**

生物活性:					
Description	Asenapine(Org 5222) inhibits adrenergic receptor (α 1, α 2A, α 2B, α 2C) with K_i of 0.25-1.2 nM and also inhibits 5-HT receptor (1A, 1B, 2A, 2B, 2C, 5A, 6, 7) with K_i of 0.03-4.0 nM. IC50 Value: 0.25-1.2 nM(K_i for adrenergic receptor); 0.03-4.0 nM(K_i for 5-HT receptor) Target: 5-HT Receptor; Adrenergic Receptor Asenapine maleate is a 5-HT receptor antagonist (5-HT1A,1B, 5-HT2A, 2B, 2C, 5-HT5A, 5-HT6 and 5-HT7), a D2 antagonist, and an antipsychotic. Asenapine has a broad receptor affinity profile for most serotonergic, dopaminergic, and adrenergic receptors, with no appreciable affinity for muscarinic receptors. Asenapine may be a helpful treatment option for patients with schizophrenia when weight gain, dyslipidemia, and endocrine abnormalities are a concern.				
	In Vitro: DMSO : 50 mg/mL (174.97 mM; Need ultrasonic) H₂O : < 0.1 mg/mL (insoluble)				
Solvent&Solubility	Preparing Stock Solutions	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.4993 mL	17.4966 mL	34.9932 mL
		5 mM	0.6999 mL	3.4993 mL	6.9986 mL
		10 mM	0.3499 mL	1.7497 mL	3.4993 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>In Vivo:</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</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.75 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (8.75 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)</p> <p>Solubility: 2.5 mg/mL (8.75 mM); Suspended solution; Need ultrasonic</p> <p>此方案可获得 2.5 mg/mL (8.75 mM)的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。</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>				



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	<p>3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.75 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (8.75 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>
References	<p>[1]. Stoner SC, Pace HA. Asenapine: a clinical review of a second-generation antipsychotic. Clin Ther. 2012 May;34(5):1023-40.</p> <p>[2]. Tarazi FI, Shahid M. Asenapine maleate: a new drug for the treatment of schizophrenia and bipolar mania. Drugs Today (Barc). 2009 Dec;45(12):865-76.</p> <p>[3]. Elsworth JD, Groman SM, Jentsch JD et al. Asenapine effects on cognitive and monoamine dysfunction elicited by subchronic phencyclidine administration. Neuropharmacology. 2012 Mar;62(3):1442-52.</p> <p>[4]. Potkin SG. Asenapine: a clinical overview. J Clin Psychiatry. 2011;72 Suppl 1:14-8.</p> <p>[5]. Shahid M, Walker GB, Zorn SH, Wong EH. Asenapine: a novel psychopharmacologic agent with a unique human receptor signature. J Psychopharmacol. 2009 Jan;23(1):65-73.</p> <p>[6]. Asenapine</p>

源叶生物