



生物活性:					
Description		Meptazinol HCl 是一种独特的中枢神经系统阿片类镇痛药,可以抑制[3H]二氢吗啡的结合, IC50 为 58nM。			
IC ₅₀ & Target		opioid receptor [1]			
In Vitro		Meptazinol 相当有效地抑制一部分 3H 标记的阿片剂和阿片肽结合, IC50 值低于 1 nM。 [1]			
In Vivo		在小鼠扭体和大鼠甩尾试验中, Naloxonazine 治疗 24 小时初期减弱 Meptazinol (10 mg/kg i.v.)镇痛作用。 Meptazinol 与吗啡一起给药不会逆转吗啡单独给药时观察到的呼吸抑制作用, 可以将 meptazinol 从其他混合的激动剂/拮抗剂中分离。 [1]在雄性 Sprague-Dawley 大鼠体内, Meptazinol (8 mg/kg i.v.)从鼻腔到体循环的吸收快速且完全。 给药后 15 分钟达到最大浓度, 绝对生物利用度为 96.06%。 Meptazinol (8 mg/kg i.v.)在脑脊液中的水平达到 2.71 μg/mL 的高浓度, 随后以指数递减。 静脉内 Meptazinol (8 mg/kg i.v.)的浓度在 10 分钟时达到最大, 随后在皮质透析液中锐减。 [2] 在膀胱镜检查患者中, Meptazinol (2 mg/kg)的内含物减少麻醉剂所需的总剂量, 可以更快恢复, 并且与较少的响应外科手术的活动相关。 外科手术期间, 相对于 Meptazinol 组, 对照组中的患者有换气过度的趋向, 并且具有较低的潮气量末 CO2 张力, 以及较高的脉搏率。 [3] Meptazinol (25 mg/kg)使伤害性阈值比在小鼠体内比在大鼠体内具有更大的增加, 而吗啡在两个物种中均诱导较大的增加。 对 Meptazinol 的镇痛响应在纳洛酮预处理的动物体内始终被抑制, 而莨菪碱会减弱 meptazinol 在小鼠, 尤其是小鼠甩尾试验中的作用。 [4]在大鼠中, Meptazinol (2 mg/kg i.v.)大大降低急性冠状动脉闭塞和心室纤维性颤动(VF)导致的室性期外收缩的发病率。 在冠状动脉阻塞的清醒大鼠中, Meptazinol 也会减少室性心律失常, 包括纤维性颤动。 [5]			
Solvent&Solubility		In Vitro: DMSO : 54 mg/mL (200.14 mM) Water: 54 mg/mL (200.14 mM) Ethanol: 54 mg/mL (200.14 mM)			
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing Stock Solutions		1 mM	3.7063 mL	18.5316 mL	37.0631 mL
		5 mM	0.7413 mL	3.7063 mL	7.4126 mL
		10 mM	0.3706 mL	1.8532 mL	3.7063 mL
		50 mM	0.0741 mL	0.3706 mL	0.7413 mL
		*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。			
		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。			
References		[1] Spiegel K, et al. J Pharmacol Exp Ther, 1984, 228(2), 414-419. [2] Shi Z, et al. Life Sci, 2005, 77(20), 2574-2583. [3] Hargreaves J, et al. Anaesthesia, 1985, 40(5), 490-493. [4] Bill DJ, et al. Br J Pharmacol, 1983, 79(1), 191-199. [5] Fagbemi O, et al. Br J Pharmacol, 1983, 78(3), 455-460.			