



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **Ramelteon**  
CAS 号: **196597-26-9**  
产品货号: **S80513**

### 生物活性:

|                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------|------------|------------|------------------------------|--------------------------|------|------|------|-------|------|--|-----------|------------|------------|------|--|-----------|-----------|-----------|-------|--|-----------|-----------|
| Description                  | Ramelteon 是一种强效、高选择性和具有口服活性的 MT1/MT2 激动剂, Ki 值分别为 14 和 112 pM。Ramelteon 具有研究失眠症的潜力。Ramelteon 长期使用持续减少睡眠发作, 停药后无翌日晨残留效应或反弹性失眠或戒断症状.                                                                                                                                                                                               |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
| IC50 & Target                | MT2                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | MT1                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
| In Vivo                      | <p>Ramelteon (口服 0.1 和 1 mg/kg) 加速将跑轮活动节律重新引入新的光暗循环[3]。</p> <p>Ramelteon (口服 3、10 和 30 mg/kg) 不影响通过水迷宫任务和延迟匹配位置任务测试的大鼠的学习或记忆, 这意味着 MT1/MT2 受体激动剂没有滥用潜力[3]。</p> <p>Ramelteon (0.0001、0.001、0.01 和 0.1 mg/kg; 口服; 8 小时) 在 0.001、0.01 和 0.1 mg/kg 的剂量下显著降低觉醒, 在 0.001、0.01 和 0.1 mg 的剂量下增加慢波睡眠/kg, 并以 0.1 mg/kg 的剂量增加快速眼动睡眠[4].</p> |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | Animal Model:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | Male Wistar or Fischer 344 (F344) rats[3]                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | Dosage:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | 0.1 and 1 mg/kg; 3, 10, and 30 mg/kg                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | Administration:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | p.o.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | Result:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | Accelerated reentrainment of running wheel activity rhythm to the new lightdark cycle. Ramelteon did not affect learning or memory in rats tested by the water maze task and the delayed match to position task, implying that MT1/MT2 receptor agonists have no abuse potential.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | Animal Model:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | Adult cats (2.5-6.1 kg)[4]                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | Dosage:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | 0.0001, 0.001, 0.01, and 0.1 mg/kg                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | Administration:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | p.o.; 8 hours                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | Result:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | Significantly decreased wakefulness at doses of 0.001, 0.01, and 0.1 mg/kg, increased slow-wave sleep at doses of 0.001, 0.01, and 0.1 mg/kg, and increased rapid eye movement sleep at a dose of 0.1 mg/kg.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |           |            |            |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | Solvent&Solubility                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | <p><b>细胞实验:</b></p> <p>DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (385.58 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)</p> <table><tr><td rowspan="4">Preparing<br/>Stock Solutions</td><td>Solvent<br/>Concentration</td><td>Mass</td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td></td><td>3.8558 mL</td><td>19.2790 mL</td><td>38.5581 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td></td><td>0.7712 mL</td><td>3.8558 mL</td><td>7.7116 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td></td><td>0.3856 mL</td><td>1.9279 mL</td><td>3.8558 mL</td></tr></table> <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°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。</p> <p><b>动物实验:</b></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。</p> |           |            |            | Preparing<br>Stock Solutions | Solvent<br>Concentration | Mass | 1 mg | 5 mg | 10 mg | 1 mM |  | 3.8558 mL | 19.2790 mL | 38.5581 mL | 5 mM |  | 0.7712 mL | 3.8558 mL | 7.7116 mL | 10 mM |  | 0.3856 mL | 1.9279 mL |
| Preparing<br>Stock Solutions | Solvent<br>Concentration                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | Mass                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | 1 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | 3.8558 mL | 19.2790 mL | 38.5581 mL |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | 5 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | 0.7712 mL | 3.8558 mL  | 7.7116 mL  |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |
|                              | 10 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | 0.3856 mL | 1.9279 mL  | 3.8558 mL  |                              |                          |      |      |      |       |      |  |           |            |            |      |  |           |           |           |       |  |           |           |



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

|                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                          |      |       |       |       |  |  |  |  |
|---------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|------|-------|-------|-------|--|--|--|--|
|                                                                                 | <p>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；</p> <p>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>方案 一</p> <p>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 (9.64 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（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；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。</p> <p>生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH<sub>2</sub>O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。</p> <p>方案 二</p> <p>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 (9.64 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（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>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。</p> <p>方案 三</p> <p>请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.64 mM); 澄清溶液</p> <p>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。</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> |                          |      |       |       |       |  |  |  |  |
| 参考文献                                                                            | <p>[1]. Kato K, et al. Neurochemical properties of ramelteon (TAK-375), a selective MT1/MT2 receptor agonist. Neuropharmacology. 2005;48(2):301-310.</p> <p>[2]. Mayer G, et al. Efficacy and safety of 6-month nightly ramelteon administration in adults with chronic primary insomnia. Sleep. 2009;32(3):351-360.</p> <p>[3]. Hirai K, et al. Ramelteon (TAK-375) accelerates reentrainment of circadian rhythm after a phase advance of the light-dark cycle in rats. J Biol Rhythms. 2005;20(1):27-37.</p> <p>[4]. Miyamoto M, et al. The sleep-promoting action of ramelteon (TAK-375) in freely moving cats. Sleep. 2004;27(7):1319-1325.</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                          |      |       |       |       |  |  |  |  |
| 完整储备液配制表：                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                          |      |       |       |       |  |  |  |  |
| 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                          |      |       |       |       |  |  |  |  |
| 可选溶剂                                                                            | <table><tr><td rowspan="2">质量<br/><br/>溶剂体积<br/><br/>浓度</td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td><td>25 mg</td></tr><tr><td></td><td></td><td></td><td></td></tr></table>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | 质量<br><br>溶剂体积<br><br>浓度 | 1 mg | 5 mg  | 10 mg | 25 mg |  |  |  |  |
| 质量<br><br>溶剂体积<br><br>浓度                                                        | 1 mg                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                          | 5 mg | 10 mg | 25 mg |       |  |  |  |  |
|                                                                                 |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                          |      |       |       |       |  |  |  |  |



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyysw@sina.com

|      |        |           |            |            |            |
|------|--------|-----------|------------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM   | 3.8558 mL | 19.2790 mL | 38.5581 mL | 96.3952 mL |
|      | 5 mM   | 0.7712 mL | 3.8558 mL  | 7.7116 mL  | 19.2790 mL |
|      | 10 mM  | 0.3856 mL | 1.9279 mL  | 3.8558 mL  | 9.6395 mL  |
|      | 15 mM  | 0.2571 mL | 1.2853 mL  | 2.5705 mL  | 6.4263 mL  |
|      | 20 mM  | 0.1928 mL | 0.9640 mL  | 1.9279 mL  | 4.8198 mL  |
|      | 25 mM  | 0.1542 mL | 0.7712 mL  | 1.5423 mL  | 3.8558 mL  |
|      | 30 mM  | 0.1285 mL | 0.6426 mL  | 1.2853 mL  | 3.2132 mL  |
|      | 40 mM  | 0.0964 mL | 0.4820 mL  | 0.9640 mL  | 2.4099 mL  |
|      | 50 mM  | 0.0771 mL | 0.3856 mL  | 0.7712 mL  | 1.9279 mL  |
|      | 60 mM  | 0.0643 mL | 0.3213 mL  | 0.6426 mL  | 1.6066 mL  |
|      | 80 mM  | 0.0482 mL | 0.2410 mL  | 0.4820 mL  | 1.2049 mL  |
|      | 100 mM | 0.0386 mL | 0.1928 mL  | 0.3856 mL  | 0.9640 mL  |

源叶