



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: shyyssw@sina.com

产品名称: **Tianeptine**
CAS 号: **72797-41-2**
产品货号: **S86336**

生物活性:											
Description	Tianeptine 是一种非典型抗抑郁剂。Tianeptine 是 μ-阿片受体 (MOR) 的中等强度激动剂,也是 δ-阿片受体 (DOR) 的较小程度激动剂。Tianeptine 是一种谷氨酸调节剂,能够增强 AMPA 受体 (AMPA receptor) 并拮抗 NMDA 受体 (NMDA receptor)。Tianeptine 可减少应激/炎症诱导条件下发挥神经保护作用,起抗炎和抗氧化作用。Tianeptine 通过抑制 PI3K/Akt 介导的 NF-κB 通路来抑制 MMP-9。Tianeptine 可用于缓解抑郁和焦虑症状,但不具有镇静作用[1][2][3][4][5]。										
IC50 & Target[2][5]	μ Opioid Receptor/MOR δ Opioid Receptor/DOR MMP-9 Akt PI3K NF- κ B										
In Vitro	Tianeptine 通过刺激 MOR 抑制小胶质细胞/巨噬细胞极化为促炎 (M1) 表型,并提高抗氧化酶 (如超氧化物歧化酶 (SOD) 和过氧化氢酶) 的活性,从而减轻氧化应激损伤[2]。 Tianeptine 可提高海马和杏仁核等脑区的 BDNF 和 NGF 水平,促进海马齿状回的神经发生[2]。 Tianeptine (0.1-100 μM, 14 天) 显著降低大鼠胚胎皮质神经元缺氧诱导的 LDH 释放[4]。 Tianeptine (10 μM) 不能减少 NMDA (HY-17551) 直接诱导的神经元凋亡,但在 IL-1β 存在下,对小鼠皮质神经元具有显著的保护作用[4]。 Tianeptine (0-500 μM, 1-24 小时) 通过抑制 PI3K/Akt 介导的 NF-κB 通路和抑制 MMP-9 的表达,减弱了 LNCaP 细胞的侵袭能力,而不诱导细胞凋亡[5]。 Cell Invasion Assay[5] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>LNCaP cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>500 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 h</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Significantly attenuated TNF-α-stimulated cancer cell invasion.</td></tr></table>	Cell Line:	LNCaP cells	Concentration:	500 μ M	Incubation Time:	24 h	Result:	Significantly attenuated TNF- α -stimulated cancer cell invasion.		
Cell Line:	LNCaP cells										
Concentration:	500 μ M										
Incubation Time:	24 h										
Result:	Significantly attenuated TNF- α -stimulated cancer cell invasion.										
In Vivo	Tianeptine (10 和 50 mg/kg, 腹腔注射, 单剂量) 选择性拮抗中枢 5-HT 升高引起的生理和行为效应 (体重减轻), 但不影响外周 5-HT 升高引起的效应 (皮质酮释放) [1]。 Tianeptine 不会改变大鼠细胞外血清素的速率, 因此不会增加或减少血清素的再摄取[2]。 Tianeptine 可改善应激引起的认知缺陷和记忆障碍, 并增强学习能力和空间记忆[2]。 Tianeptine (5-10 mg/kg, 腹腔注射, 单剂量) 在小鼠热板和甩尾热痛模型中均表现出显著的镇痛作用, 且不引起运动功能障碍[3]。 Tianeptine (1-10 mg/kg, 腹腔注射, 单次给药或每日两次, 连续 5 天) 表现出神经保护作用, 这种作用并非通过直接拮抗 NMDA 受体实现, 而是仅在炎症/细胞因子激发的病理条件下才能完全激活[4]。 <table><tr><td>Animal Model:</td><td>Corticosterone release assay established in male Wistar rats, weighing initially 260-280 g[1]</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>10 mg/kg (without Benserazide (HY-121275)) and 50 mg/kg (with Benserazide)</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>Intraperitoneal injection (i.p.), single dose</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Did not antagonize 5-HTP-induced peripheral corticosterone release. Specifically antagonized the appetite suppression and weight loss effects caused by increased central 5-HT.</td></tr><tr><td>Animal Model:</td><td>Hot-plate and tail-flick model established in adult male Swiss Webster mice (25-32 g)[3]</td></tr></table>	Animal Model:	Corticosterone release assay established in male Wistar rats, weighing initially 260-280 g[1]	Dosage:	10 mg/kg (without Benserazide (HY-121275)) and 50 mg/kg (with Benserazide)	Administration:	Intraperitoneal injection (i.p.), single dose	Result:	Did not antagonize 5-HTP-induced peripheral corticosterone release. Specifically antagonized the appetite suppression and weight loss effects caused by increased central 5-HT.	Animal Model:	Hot-plate and tail-flick model established in adult male Swiss Webster mice (25-32 g)[3]
Animal Model:	Corticosterone release assay established in male Wistar rats, weighing initially 260-280 g[1]										
Dosage:	10 mg/kg (without Benserazide (HY-121275)) and 50 mg/kg (with Benserazide)										
Administration:	Intraperitoneal injection (i.p.), single dose										
Result:	Did not antagonize 5-HTP-induced peripheral corticosterone release. Specifically antagonized the appetite suppression and weight loss effects caused by increased central 5-HT.										
Animal Model:	Hot-plate and tail-flick model established in adult male Swiss Webster mice (25-32 g)[3]										



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

	Dosage:	5 and 10 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection (i.p.), single dose			
	Result:	Significantly prolonged the latency of pain response in both the tail-flick and hot plate tests, demonstrating a strong analgesic effect at 10 mg/kg. Completely blocked the analgesic effect in both pain models pretreatment with pCPA (HY-B1368). Did not affect the performance of mice on the rotating rod.			
	Animal Model:	Model of cerebral cortex and white matter area damage established in Newborn Swiss mice on postnatal day 5 (P5)[4]			
	Dosage:	1, 3 and 10 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection (i.p.), single dose or twice daily for 5 days			
	Result:	Failed to alleviate the underlying impairment caused by ibotenate with acute or chronic administration. Effectively reversed damage exacerbated by chronic IL-1β pretreatment.			
	Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 10 mg/mL (22.89 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)			
Preparing Stock Solutions		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.2886 mL	11.4430 mL	22.8859 mL
		5 mM	0.4577 mL	2.2886 mL	4.5772 mL
		10 mM	0.2289 mL	1.1443 mL	2.2886 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。 动物实验: 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： ——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 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 1 mg/mL (2.29 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 10.0 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。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水					



	溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 1 mg/mL (2.29 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 10.0 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。 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1 mg/mL (2.29 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 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 μL 10.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。				
参考文献	[1]. Broqua P; Baudrie V; Chaouloff F Differential effects of the novel antidepressant tianeptine on L-5-hydroxytryptophan (5-HTP)-elicited corticosterone release and body weight loss. Eur Neuropsychopharmacol. 1992 Jun;2(2):115-20. [2]. Alamo C, et, al. Tianeptine, an atypical pharmacological approach to depression. Rev Psiquiatr Salud Ment. Jul-Sep 2019;12(3):170-186. [3]. Uzbay IT, et, al. Analgesic effect of tianeptine in mice. Life Sci. 1999;64(15):1313-9. [4]. Plaisant F, et, al. Neuroprotective properties of tianeptine: interactions with cytokines. Neuropharmacology. 2003 May;44(6):801-9. [5]. Jayasooriya RG, et al. Tianeptine sodium salt suppresses TNF- α -induced expression of matrix metalloproteinase-9 in human carcinoma cells via suppression of the PI3K/Akt-mediated NF- κ B pathway. Environ Toxicol Pharmacol. 2014 Sep;38(2):502-9.				
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℃, 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。					
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.2886 mL	11.4430 mL	22.8859 mL	57.2148 mL
	5 mM	0.4577 mL	2.2886 mL	4.5772 mL	11.4430 mL
	10 mM	0.2289 mL	1.1443 mL	2.2886 mL	5.7215 mL
	15 mM	0.1526 mL	0.7629 mL	1.5257 mL	3.8143 mL
	20 mM	0.1144 mL	0.5721 mL	1.1443 mL	2.8607 mL