



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: 4-P-PDOT
CAS 号: 134865-74-0
产品货号: S88242

生物活性:

Description	4-P-PDOT 是一种有效的,选择性的和亲和性的褪黑激素受体 (MT2) 拮抗剂。4-P-PDOT 对 MT2 的选择性是 MT1 的 300 倍以上。4-P-PDOT 可显著抵消褪黑激素介导的抗氧化作用 (GSH/GSSG 比, ERK 磷酸化, Nrf2 核易位, Nrf2 DNA 结合活性)。					
IC50 & Target	MT2					
In Vitro	在 CHO-mt1 细胞中,氨基四氢苯 4-P-PDOT (10 mM) 对毛喉素刺激的环 AMP 水平没有影响,无论是单独使用还是在褪黑激素存在的情况下。相反,在 CHO-MT2 细胞中,4-P-PDOT 是一种激动剂,对毛喉素刺激的环 AMP 产生浓度依赖性抑制, pEC50 值为 8.72, 内在活性为 0.86[1]。					
	Cell Viability Assay[5]					
	Cell Line:	HT-29 and HeLa cells.				
	Concentration:	50 μM				
	Incubation Time:	30 min				
Result:	Produced a negligible effect on cell viability induced by melatonin.					
In Vivo	4-P-PDOT (0.5-1.0 mg/kg; 静脉注射; klotho 突变小鼠) 治疗可显著逆转褪黑激素介导的抗氧化作用。并显著逆转这些 GSH 相关参数水平的变化。4-P-PDOT 治疗显著逆转褪黑素治疗的 klotho 突变小鼠的记忆功能。4-P-PDOT 还可以抵消 Melatonin 介导的信号衰减,该信号是 klotho 突变小鼠海马中磷酸化 ERK 表达、Nrf2 核易位、Nrf2 DNA 结合活性和 GCL mRNA 表达降低的反应[2]。					
	Animal Model:	Klotho mutant mice treatment with Melatonin[2]				
	Dosage:	0.5 mg/kg or 1.0 mg/kg				
	Administration:	Intravenous injection				
	Result:	Significantly reversed antioxidant effects mediated by Melatonin. Significantly reversed the changes in the levels of these GSH-related parameters. Significantly reversed the memory function of Melatonin-treated klotho mutant mice.				
Solvent&Solubility	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 41.67 mg/mL (149.15 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	3.5794 mL	17.8968 mL	35.7935 mL	
		5 mM	0.7159 mL	3.5794 mL	7.1587 mL	
	10 mM	0.3579 mL	1.7897 mL	3.5794 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°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 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						



	请您现用现配，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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 4.17 mg/mL (14.93 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 4.17 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 41.7 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 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 4.17 mg/mL (14.93 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 4.17 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 41.7 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]. Dubocovich ML. Melatonin receptors: are there multiple subtypes? Trends Pharmacol Sci. 1995 Feb;16(2):50-6. [2]. hin EJ, et al. Melatonin attenuates memory impairment induced by Klotho gene deficiency via interactive signaling between MT2 receptor, ERK, and Nrf2-related antioxidant potential. Int J Neuropsychopharmacol. 2014 Dec 30;18(6). pii: pyu105. [3]. Christopher Browning, et al. Pharmacological characterization of human recombinant melatonin mt1 and MT2 receptors. British Journal of Pharmacology (2000) 129, 877-886. [4]. Dubocovich ML, et al. Melatonin receptor antagonists that differentiate between the human Mella and Mel1b recombinant subtypes are used to assess the pharmacological profile of the rabbit retina ML1 presynaptic heteroreceptor. Naunyn Schmiedebergs Arch Pharmacol. 1997 Mar;355(3):365-75. [5]. Roberto Pariente, et al. Participation of MT3 melatonin receptors in the synergistic effect of melatonin on cytotoxic and apoptotic actions evoked by chemotherapeutics. Cancer Chemother Pharmacol. 2017 Nov;80(5):985-998.				
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° C, 6 months; -20° C, 1 month。-80° C 储存时，请在 6 个月内使用，-20° C 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	3.5794 mL	17.8968 mL	35.7935 mL	89.4839 mL
	5 mM	0.7159 mL	3.5794 mL	7.1587 mL	17.8968 mL
	10 mM	0.3579 mL	1.7897 mL	3.5794 mL	8.9484 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
邮箱: shyyssw@sina.com

	15 mM	0.2386 mL	1.1931 mL	2.3862 mL	5.9656 mL
	20 mM	0.1790 mL	0.8948 mL	1.7897 mL	4.4742 mL
	25 mM	0.1432 mL	0.7159 mL	1.4317 mL	3.5794 mL
	30 mM	0.1193 mL	0.5966 mL	1.1931 mL	2.9828 mL
	40 mM	0.0895 mL	0.4474 mL	0.8948 mL	2.2371 mL
	50 mM	0.0716 mL	0.3579 mL	0.7159 mL	1.7897 mL
	60 mM	0.0597 mL	0.2983 mL	0.5966 mL	1.4914 mL
	80 mM	0.0447 mL	0.2237 mL	0.4474 mL	1.1185 mL
	100 mM	0.0358 mL	0.1790 mL	0.3579 mL	0.8948 mL



源叶