



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: 阿莫伦特
产品别名: **Almorexant; ACT 078573**

生物活性:				
Description	Almorexant (ACT 078573) is a potent and competitive dual orexin 1 receptor (OX1)/orexin 2 receptor (OX2) antagonist with Ki values of 1.3 and 0.17 nM, respectively.			
IC ₅₀ & Target	IC ₅₀ : 1.3/0.7 nM(OX1/OX2 Receptor)			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 46 mg/mL (89.75 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	1.9510 mL	9.7550 mL
		5 mM	0.3902 mL	1.9510 mL
		10 mM	0.1951 mL	0.9755 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。 In Vivo: 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 1.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.88 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.88 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 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。 2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.88 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.88 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 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 生理盐水溶液中, 混合均匀。 3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.88 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.88 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。			



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

	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. Cruz HG, et al. Assessment of the abuse liability of a dual orexin receptor antagonist: a crossover study of almorexant and zolpidem in recreational drug users. <i>CNS Drugs</i>. 2014 Apr;28(4):361-72. [2]. Dayot S, et al. In vitro, in vivo and ex vivo demonstration of the antitumoral role of hypocretin-1/orexin-A and almorexant in pancreatic ductal adenocarcinoma. <i>Oncotarget</i>. 2018 Jan 9;9(6):6952-6967. [3]. Malherbe P, et al. Biochemical and electrophysiological characterization of almorexant, a dual orexin 1 receptor (OX1)/orexin 2 receptor (OX2) antagonist: comparison with selective OX1 and OX2 antagonists. <i>Mol Pharmacol</i>. 2009 Sep;76(3):618-31. [4]. Sifferlen T, et al. Novel pyrazolo-tetrahydropyridines as potent orexin receptor antagonists. <i>Bioorg Med Chem Lett</i>. 2010 Mar 1;20(5):1539-42. [5]. Black SW, et al. Almorexant promotes sleep and exacerbates cataplexy in a murine model of narcolepsy. <i>Sleep</i>. 2013 Mar 1;36(3):325-36.

源叶生物