Rapporti pubblicati su Melanotan II

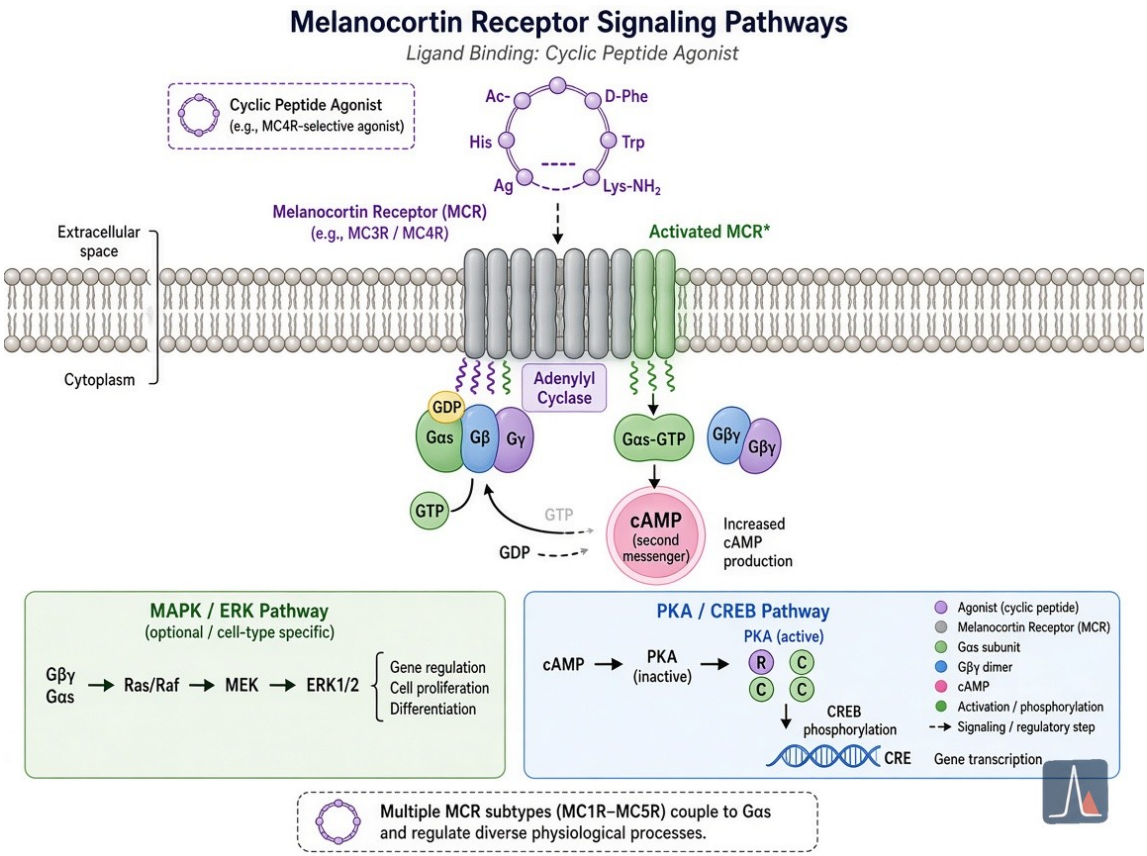
30 ottobre 2026

I rapporti pubblicati caratterizzano Melanotan II come un eptapeptide ciclico sintetico, agonista non selettivo dei recettori della melanocortina, con dati preclinici sulla melanogenesi, sulla soppressione dell'appetito e sul comportamento sessuale, piccoli studi clinici umani precoci che mostrano ta

Rapporti pubblicati su Melanotan II

I rapporti pubblicati caratterizzano Melanotan II (noto anche come MT-II o Melanotan-2) come un eptapeptide ciclico sintetico, agonista non selettivo dei recettori della melanocortina ([Ac-Nle4-c[Asp5-His6-D-Phe7-Arg8-Trp9-Lys10]-NH2]), sviluppato tra la fine degli anni 1980 e l'inizio degli anni 1990 presso la University of Arizona. È stato studiato in ambito preclinico per la melanogenesi mediata da MC1R, la soppressione dell'appetito e la motivazione sessuale mediate da MC4R, nonché in limitati studi clinici umani precoci per l'abbronzatura indipendente dagli UV e la disfunzione erettile. Questi piccoli studi clinici (in totale circa 23 uomini) hanno dimostrato induzione dell'abbronzatura e dell'erezione, ma sono stati limitati da nausea marcata; lo sviluppo è stato interrotto a favore di analoghi più selettivi quali bremelanotide (PT-141). L'ampio uso preclinico come strumento farmacologico ha generato dati solidi sulla pigmentazione, sul comportamento alimentare e sulla funzione sessuale in modelli animali, con uno studio recente che esplora effetti antitumorali topici. L'autosomministrazione non regolamentata è stata associata a case report di alterazioni melanocitiche (nevi eruttivi o in scurimento), diagnosi di melanoma (associazione, non causalità dimostrata, spesso con esposizione agli UV), priapismo, rabdomiolisi, complicanze renali e problemi di qualità del prodotto. Non esistono studi controllati randomizzati su larga scala, dati di sicurezza a lungo termine né approvazioni regolatorie per alcuna indicazione. Nel 2026 è stato registrato uno studio di Fase 2 che indaga l'uso aggiuntivo con UVB a banda stretta nella vitiligine. La segnalazione di studi sull'uomo non costituisce una guida all'uso del materiale di ricerca in tal modo. Tutti i materiali di Rierink Compounds sono destinati esclusivamente alla ricerca di laboratorio e non sono medicinali.

Tutte le informazioni e i prodotti trattati sono destinati esclusivamente all'uso di laboratorio e di ricerca. Non per uso umano o veterinario. Non destinati a diagnosticare, trattare, curare o prevenire alcuna malattia.



Farmacologia recettoriale in vitro di Melanotan II.

Identità chimica e contesto di catalogo

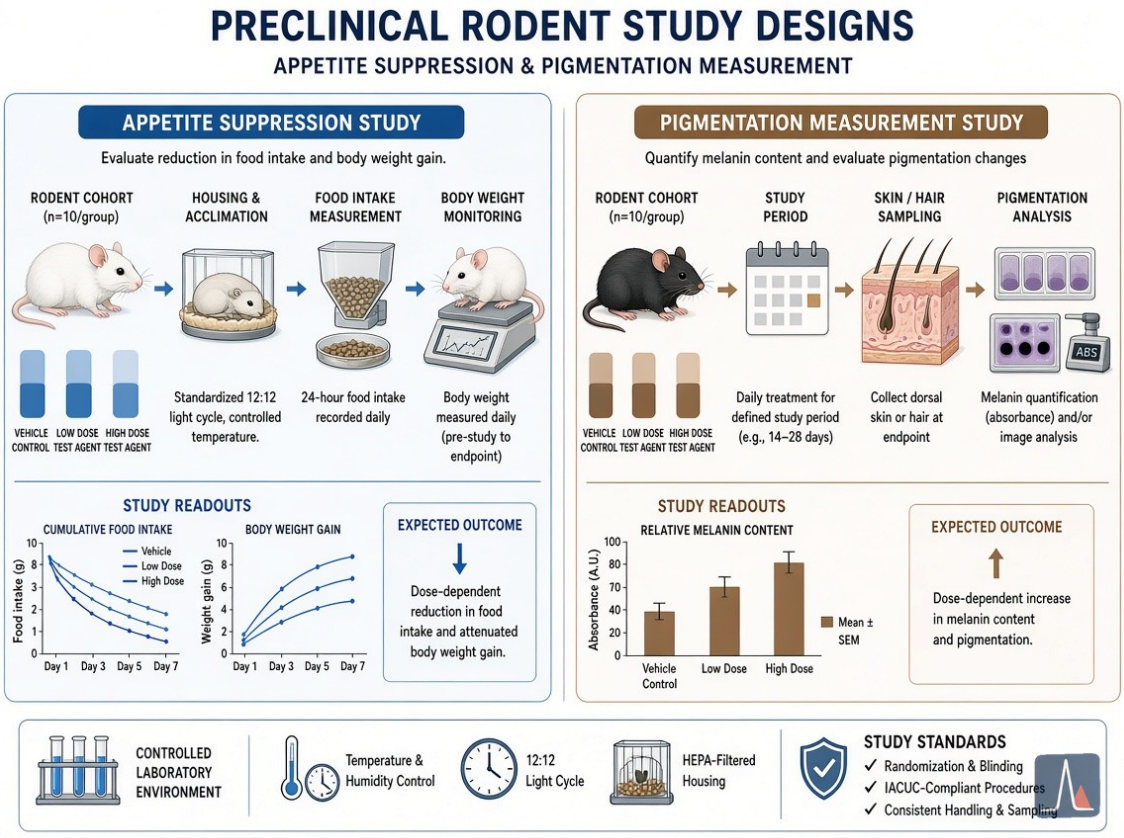
Melanotan II è un analogo eptapeptidico ciclico a ponte lattamico, conformazionalmente vincolato, dell'ormone α-melanocito-stimolante (α-MSH), progettato per migliorare la stabilità metabolica e la potenza rispetto al peptide nativo di 13 aminoacidi. La struttura presenta la sostituzione Nle4, un ponte lattamico tra Asp5 e Lys10 e il farmacoforo centrale His6-D-Phe7-Arg8-Trp9 che conferisce superpotenza sui recettori della melanocortina. Agisce come agonista non selettivo con affinità massima per MC1R (pigmentazione) e attività significativa su MC3R, MC4R (regolazione centrale dell'appetito e sessuale) e MC5R. Questo profilo lo distingue dal più selettivo per MC1R Melanotan I (afamelanotide), che ha ottenuto l'approvazione regolatoria per la protoporfiria eritropoietica. Nel catalogo Rierink, Melanotan II è offerto insieme a strumenti di ricerca e analoghi correlati della melanocortina quali PT-141 per ricercatori di laboratorio qualificati che studiano la farmacologia recettoriale, le vie della pigmentazione o la segnalazione neuroendocrina. Non è destinato alla somministrazione umana o animale.

Scoperta fondativa, farmacologia recettoriale e studi meccanicistici in vitro (articoli in_vitro e metodologici, 1989–2010s)

Il composto è stato progettato e sintetizzato nei laboratori di Hruby e Hadley presso la University of Arizona nell'ambito di un programma volto a creare analoghi dell'α-MSH superpotenti e stabili dal punto di vista enzimatico. I primi articoli metodologici (fine anni

Tutte le informazioni e i prodotti trattati sono destinati esclusivamente all'uso di laboratorio e di ricerca. Non per uso umano o veterinario. Non destinati a diagnosticare, trattare, curare o prevenire alcuna malattia.

1980–anni 1990) hanno descritto sintesi in fase di soluzione e in fase solida, strategie di ciclizzazione lattamica e relazioni struttura-attività che hanno identificato la sostituzione D-Phe7 e il vincolo ciclico come elementi chiave per una maggiore potenza e durata. Studi in vitro condotti con biosaggi su pelle di rana, colture di melanociti di mammifero e linee cellulari transfettate (CHO, HEK293) esprimenti recettori della melanocortina umani hanno dimostrato affinità di legame nanomolari e sub-nanomolari (Ki 0.67 nM per hMC1R, 6.6 nM per hMC4R) e potenza funzionale nei saggi di accumulo di cAMP e di produzione di melanina, superiori all'α-MSH nativo per diversi sottotipi. Articoli successivi hanno perfezionato i protocolli di legame con radioligandi, esplorato la segnalazione a valle (attivazione della tirosinasi, trascrizione di MITF) e confrontato i profili di selettività tra i cinque sottotipi di MCR. Questi studi fondativi in vitro e metodologici hanno stabilito MT-II come utile strumento farmacologico per l'analisi della biologia delle melanocortine, ma hanno anche evidenziato la sua mancanza di selettività recettoriale rispetto ad analoghi successivi. Dalla sola farmacologia recettoriale su base cellulare non è possibile trarre alcuna conclusione sulla sicurezza o sull'efficacia nell'uomo.



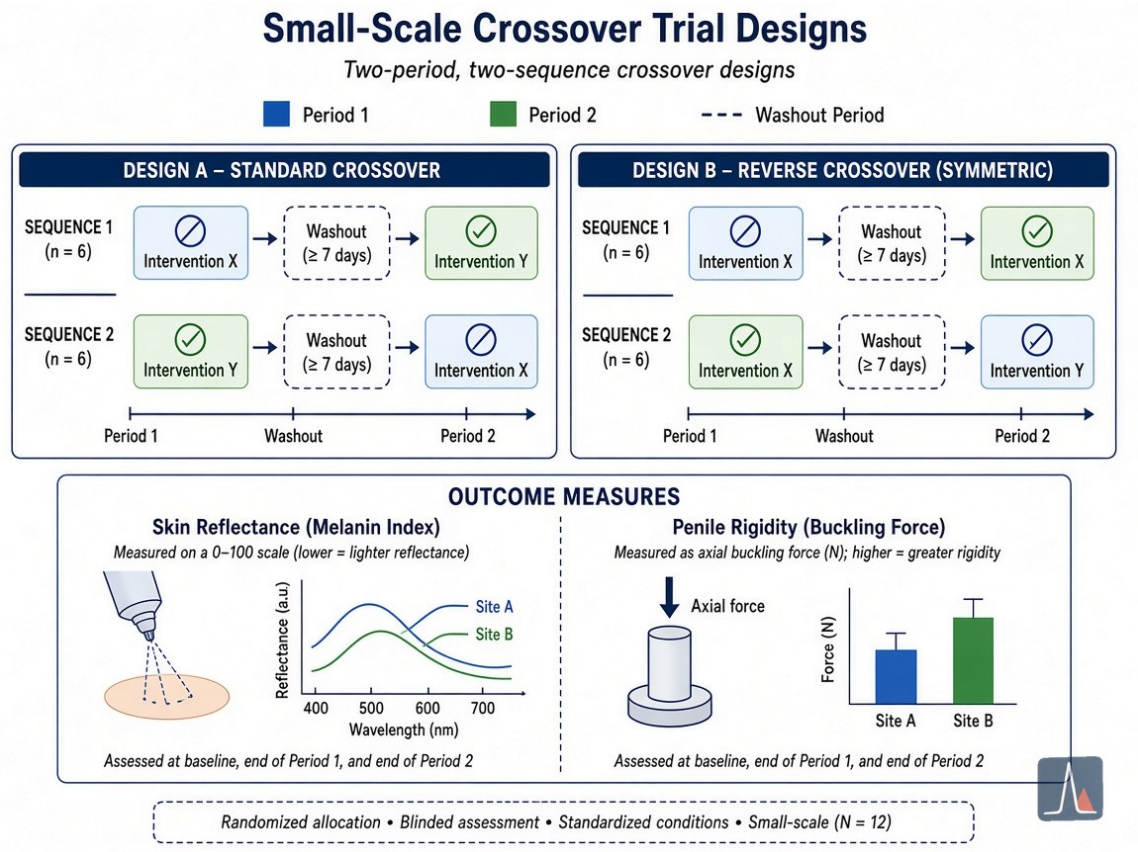
Modelli preclinici di melanogenesi e comportamento alimentare.

Modelli animali preclinici di melanogenesi, regolazione dell'appetito, comportamento sessuale e altri effetti (articoli su animali, anni 1990–2026)

Modelli di roditori e di altri animali hanno caratterizzato ampiamente MT-II. Nei saggi di pigmentazione, la somministrazione sottocutanea o centrale ha indotto la produzione di eumelanina e un visibile scurimento in ceppi a pelle chiara senza esposizione ultravioletta, in

Tutte le informazioni e i prodotti trattati sono destinati esclusivamente all'uso di laboratorio e di ricerca. Non per uso umano o veterinario. Non destinati a diagnosticare, trattare, curare o prevenire alcuna malattia.

modo coerente con l'agonismo di MC1R. Gli studi sull'alimentazione in molteplici paradigmi (a digiuno, indotti da neuropeptide Y, ob/ob, obesi indotti dalla dieta) hanno mostrato in modo costante riduzioni acute dell'assunzione di cibo e del peso corporeo, mediate principalmente da MC4R centrale; alcune pubblicazioni hanno segnalato un aumento del dispendio energetico e della termogenesi del tessuto adiposo bruno, sebbene una rapida tachifilassi (tolleranza entro pochi giorni) abbia spesso limitato l'efficacia cronica. I modelli di comportamento sessuale in ratti maschi hanno dimostrato effetti pro-erettili attraverso il nucleo paraventricolare e vie spinali, indipendenti dal nitric oxide in alcuni paradigmi; studi su ratte hanno mostrato comportamenti procettivi potenziati (salti, scatti, movimento delle orecchie) in condizioni di priming ormonale. Ulteriori lavori su animali hanno esplorato proprietà neuroprotettive in modelli di schiacciamento nervoso, miglioramento della memoria in paradigmi di dieta ricca di grassi e attenuazione di tratti simili all'autismo in modelli di attivazione immunitaria materna. Uno studio del 2020 ha riportato che MT-II topico ha soppresso la progressione del melanoma B16-F10 nei topi attraverso l'upregulation di PTEN dipendente da MC1R e l'inibizione di COX-2. Questi risultati preclinici illustrano l'ampiezza della fisiologia delle melanocortine, ma non possono essere estrapolati direttamente all'uomo; molti effetti (in particolare quelli metabolici) mostrano dipendenza dalla specie o dal contesto, e gli studi a lungo termine sono limitati. La teoria suggerisce che un agonismo sostenuto di MC4R potrebbe plausibilmente influenzare il bilancio energetico umano, ma ciò resta non verificato in contesti clinici controllati.



Primi studi pilota nell'uomo e studi sulla disfunzione erettile.

Studi pilota umani precoci e studi crossover randomizzati su

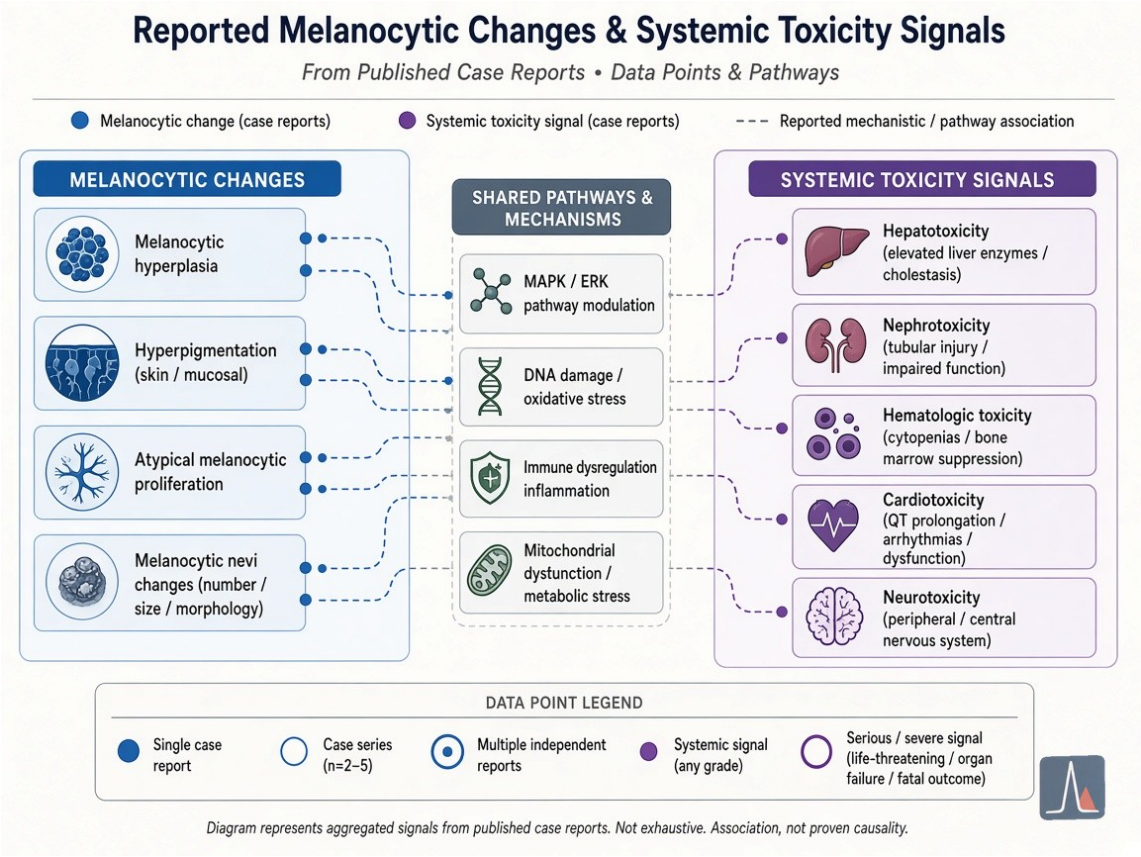
Tutte le informazioni e i prodotti trattati sono destinati esclusivamente all'uso di laboratorio e di ricerca. Non per uso umano o veterinario. Non destinati a diagnosticare, trattare, curare o prevenire alcuna malattia.

abbronzatura e disfunzione erettile (articoli clinici, 1996–2000)

Le evidenze sull'uomo sono limitate a tre piccoli studi del gruppo dell'Arizona. Il pilota in singolo cieco del 1996 (n=3 uomini sani) ha somministrato MT-II per via sottocutanea a dosi crescenti (0.01–0.03 mg/kg) a giorni alterni per due settimane. Due dei tre soggetti hanno mostrato aumenti misurabili della pigmentazione cutanea (viso, parte superiore del corpo, glutei) mediante spettrofotometria a riflettanza e valutazione visiva una settimana dopo la dose finale, senza esposizione deliberata ai raggi UV. Gli effetti indesiderati hanno incluso nausea lieve alla maggior parte delle dosi, una caratteristica risposta di sbadiglio e stiramento, erezioni peniene spontanee della durata di 1–5 ore e sonnolenza/affaticamento alla dose più elevata in un soggetto. Gli autori hanno concluso che MT-II poteva indurre l'abbronzatura dopo poche dosi basse e hanno raccomandato 0.025 mg/kg per ulteriori valutazioni.

Due successivi studi crossover in doppio cieco, controllati con placebo (totale ~20 uomini con fattori di rischio di disfunzione erettile psicogena o organica) hanno testato 0.025 mg/kg di MT-II per via sottocutanea mediante monitoraggio RigiScan in tempo reale. Nello studio del 1998 sulla DE psicogena (n=10), erezioni clinicamente evidenti si sono verificate in 8 uomini su 10 con il trattamento attivo rispetto a un valore prossimo a zero con il placebo; la durata media della rigidità della punta >80% è stata di 38 minuti contro 3 minuti (p=0.0045). Lo studio del 2000 in uomini con fattori di rischio organici e le analisi aggregate hanno riportato erezioni dopo 12 iniezioni su 19 rispetto a 1 dose di placebo su 21, con aumento del desiderio sessuale soggettivo (68% vs 19% delle dosi). Nausea e sbadigli sono stati segnalati più frequentemente con MT-II; nausea grave si è verificata dopo circa il 13% delle dosi attive in un'analisi. Non sono stati osservati eventi avversi gravi che richiedessero un intervento in questi contesti supervisionati. Questi studi hanno fornito una prova di concetto fondamentale del coinvolgimento della melanocortina centrale nella motivazione sessuale umana e hanno confermato il potenziale di abbronzatura, ma erano limitati da campioni esigui, partecipanti esclusivamente di sesso maschile, breve durata e assenza di endpoint di protezione dai raggi UV o metabolici. Hanno direttamente orientato il programma di modificazione strutturale che ha prodotto bremelanotide.

Tutte le informazioni e i prodotti trattati sono destinati esclusivamente all'uso di laboratorio e di ricerca. Non per uso umano o veterinario. Non destinati a diagnosticare, trattare, curare o prevenire alcuna malattia.

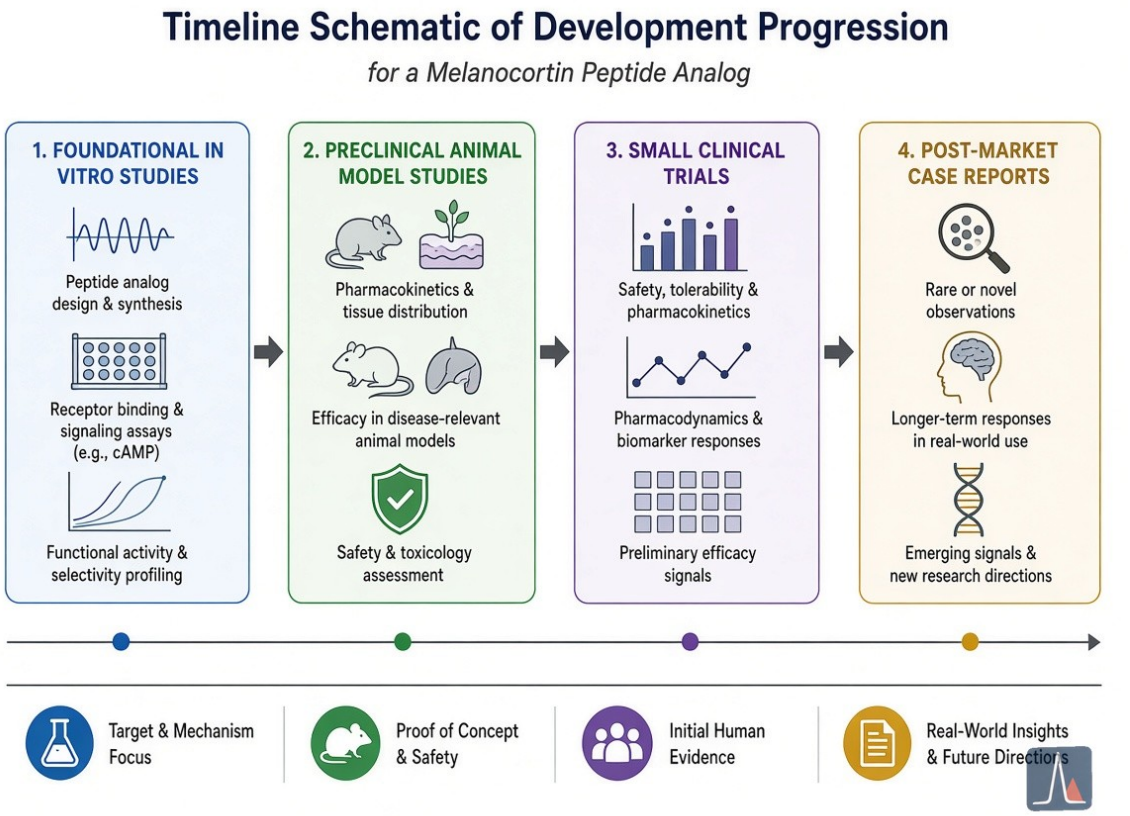


Associazioni di eventi avversi nelle pubblicazioni.

Segnalazioni di casi di eventi avversi dermatologici, melanocitari e sistemici da uso non regolamentato (case report, 2012–2026)

Dopo gli studi iniziali, MT-II di provenienza internet non regolamentato (iniettabile o nasale) è stato associato a numerose segnalazioni di casi pubblicate. I temi ricorrenti includono un rapido scurimento o la comparsa di nevi nuovi e atipici, iperpigmentazione persistente della mucosa orale o gengivale e diversi casi di melanoma (in situ o invasivo) insorti in nei preesistenti, talvolta in pazienti giovani con uso concomitante intenso di lettini solari. Le rassegne dermatologiche (inclusa una sintesi del 2017) hanno catalogato almeno quattro casi di melanoma temporalmente associati ai peptidi melanotan, rilevando che, sebbene la stimolazione di MC1R dei melanociti fornisca una plausibilità biologica, una causalità definitiva è difficile da stabilire dati il comportamento di ricerca dei raggi UV come fattore confondente e i fattori genetici. Altre segnalazioni descrivono priapismo che ha richiesto un intervento di emergenza, tossicità simpaticomimetica con rabdomiolisi e danno renale acuto dopo iniezione ad alto dosaggio, infarto renale e sindrome da encefalopatia posteriore reversibile. Studi analitici su flaconi sequestrati o consegnati dai pazienti rivelano frequentemente impurezze, dosaggio non corretto o aggregazione che potrebbero aggravare l'immunogenicità o la tossicità. Queste segnalazioni di casi riflettono la sperimentazione autonoma nel mondo reale piuttosto che un uso supervisionato e non possono quantificare l'incidenza; rappresentano tuttavia la letteratura clinica predominante successiva al 2000 e hanno indotto avvertenze regolatorie da parte delle autorità sanitarie sugli agenti abbronzanti non autorizzati.

Tutte le informazioni e i prodotti trattati sono destinati esclusivamente all'uso di laboratorio e di ricerca. Non per uso umano o veterinario. Non destinati a diagnosticare, trattare, curare o prevenire alcuna malattia.



Panoramica dei tipi di studio pubblicati e dei risultati relativi a Melanotan II.

Sintesi delle evidenze, contesto normativo, ricerca in corso e limitazioni ricorrenti (articoli di revisione e di registro, 2006–2026)

Le revisioni sistematiche e narrative rilevano in modo coerente la scarsità di dati umani di elevata qualità, il ricorso a piccoli studi degli anni Novanta condotti da un unico gruppo, l'assenza di programmi di Phase 3 e la mancanza di valutazioni di sicurezza o efficacia a lungo termine per l'abbronzatura, la gestione del peso o la fotoprotezione. Esse collocano MT-II come un importante composto strumento storico che ha chiarito le vie dei melanocortini nella funzione sessuale e nel bilancio energetico, ma ne evidenziano la non selettività e la propensione a indurre nausea quali motivi della deprioritizzazione clinica a favore di agenti selettivi per MC1R (afamelanotide) o mirati a MC4R. I documenti normativi elencano MT-II tra i peptidi non approvati con segnali di sicurezza documentati; le agenzie hanno emesso avvertenze in merito al rischio di melanoma, alla contaminazione dei prodotti e alla commercializzazione illegale per uso cosmetico. Sintesi recenti sui peptidi non regolamentati di "biohacking" ribadiscono tali preoccupazioni e rilevano evidenze analitiche di purezza variabile. Uno studio di Phase 2 registrato nel 2026 (n stimato 60) sta valutando MT-II più narrow-band UVB rispetto alla sola UVB nella vitiligine non segmentale stabile: il primo nuovo studio interventistico sull'uomo da decenni. Le limitazioni ricorrenti nella letteratura includono i primi studi condotti solo su soggetti di sesso maschile, il follow-up breve, i fattori confondenti nelle segnalazioni di casi, la rapida tolleranza nei modelli metabolici e l'assenza di studi randomizzati moderni, adeguatamente dimensionati, con endpoint dermatologici, metabolici o di sicurezza oggettivi. Sebbene i dati preclinici restino estesi e le conoscenze meccanicistiche preziose, la

Tutte le informazioni e i prodotti trattati sono destinati esclusivamente all'uso di laboratorio e di ricerca. Non per uso umano o veterinario. Non destinati a diagnosticare, trattare, curare o prevenire alcuna malattia.

base di evidenze traslazionali per l'applicazione umana è ristretta e temperata da rischi documentati.

Il corpus pubblicato su Melanotan II illustra pertanto sia l'utilità scientifica degli agonisti dei melanocortini come strumenti di ricerca sia le sostanziali lacune che permangono prima che eventuali risultati di laboratorio possano informare uno sviluppo terapeutico regolamentato. Futuri studi ben progettati dovrebbero affrontare la selettività, la tollerabilità, la sicurezza a lungo termine dei melanociti e una rigorosa caratterizzazione del prodotto.

Fonti

• Dorr RT, et al. Evaluation of melanotan-II, a superpotent cyclic melanotropic peptide in a pilot phase-I clinical study. Life Sci. 1996. PMID: 8637402. DOI: 10.1016/0024-3205(96)00160-9.
• Wessells H, et al. Synthetic melanotropic peptide initiates erections in men with psychogenic erectile dysfunction. J Urol. 1998. PMID: 9679884.
• Wessells H, et al. Melanocortin receptor agonists, penile erection, and sexual motivation: human studies with Melanotan II. Int J Impot Res. 2000. PMID: 11035391.
• Wessells H, et al. Melanotan II in the treatment of organic erectile dysfunction. Urology. 2000. PMID: 11018622.
• Hjuler KF, Lorentzen HF. Melanoma associated with the use of melanotan-II. Dermatology. 2014. PMID: 24355990.
• Nelson ME, et al. Melanotan II injection resulting in systemic toxicity and rhabdomyolysis. Clin Toxicol (Phila). 2012. PMID: 23121206.
• Topical MTII Therapy Suppresses Melanoma Through PTEN Upregulation and Cyclooxygenase II Inhibition. Int J Mol Sci. 2020. PMID: 31968661. PMC7013727.
• Habbema L, et al. Risks of unregulated use of alpha-melanocyte-stimulating hormone analogues. Int J Dermatol. 2017. PMID: 28266027.
• Ulteriori articoli di binding, su animali, casi e revisioni identificati mediante ricerche su PubMed/Europe PMC (anni Novanta–2026).

Tutte le informazioni e i prodotti discussi sono destinati esclusivamente all'uso di laboratorio e di ricerca. Non per uso umano o veterinario. Non destinati a diagnosticare, trattare, curare o prevenire alcuna malattia.

Tutte le informazioni e i prodotti trattati sono destinati esclusivamente all'uso di laboratorio e di ricerca. Non per uso umano o veterinario. Non destinati a diagnosticare, trattare, curare o prevenire alcuna malattia.