Opublikowane raporty dotyczące Melanotan II

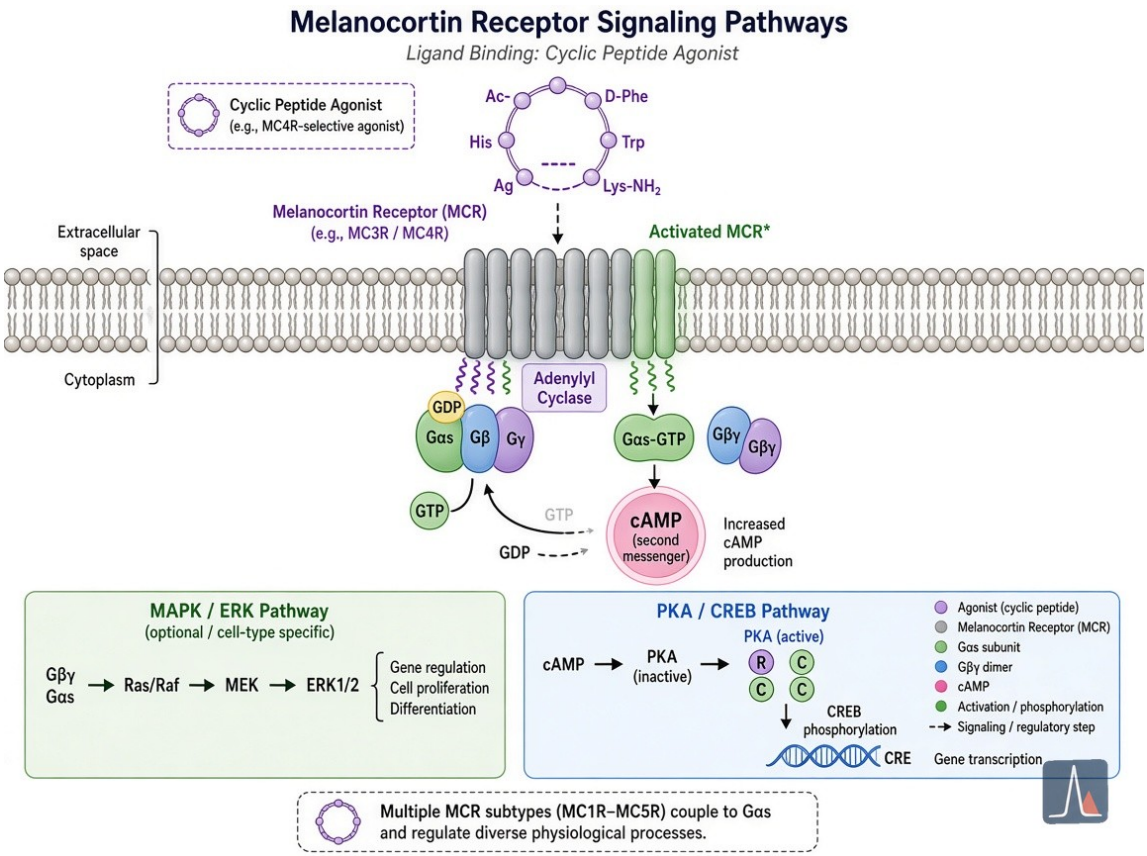
30 października 2026

Opublikowane raporty charakteryzują Melanotan II jako syntetyczny cykliczny heptapeptyd, nieselektywnego agonistę receptora melanokortynowego, z danymi przedklinicznymi dotyczącymi melanogenezy, hamowania apetytu i zachowań seksualnych, małymi wczesnymi badaniami na ludziach wykazującymi ta

Opublikowane raporty dotyczące Melanotan II

Opublikowane raporty charakteryzują Melanotan II (znany również jako MT-II lub Melanotan-2) jako syntetyczny cykliczny heptapeptyd, nieselektywnego agonistę receptora melanokortynowego ([Ac-Nle4-c[Asp5-His6-D-Phe7-Arg8-Trp9-Lys10]-NH2]), opracowanego pod koniec lat 80. i na początku lat 90. XX wieku na University of Arizona. Badano go przedklinicznie pod kątem melanogenezy mediowanej przez MC1R, hamowania apetytu i motywacji seksualnej zależnych od MC4R oraz w ograniczonych wczesnych badaniach na ludziach pod kątem opalania niezależnego od UV i zaburzeń erekcji. Te niewielkie badania kliniczne (łącznie ~23 mężczyzn) wykazały opalanie i wywoływanie erekcji, lecz były ograniczone przez nasiloną nudność; rozwój przerwano na rzecz bardziej selektywnych analogów, takich jak bremelanotide (PT-141). Szerokie przedkliniczne zastosowanie jako narzędzia farmakologicznego dostarczyło solidnych danych dotyczących pigmentacji, zachowań żywieniowych i funkcji seksualnych w modelach zwierzęcych, a jedno z nowszych badań dotyczyło miejscowych działań przeciwnowotworowych. Nieregulowane samodzielne podawanie powiązano z opisami przypadków zmian melanocytarnych (wysypkowych lub ciemniejących znamion), rozpoznań czerniaka (związek, nieudowodniony związek przyczynowy, często z ekspozycją na UV), priapizmu, rabdomiolizy, powikłań nerkowych oraz problemów z jakością produktu. Nie istnieją zakrojone na dużą skalę randomizowane badania kontrolowane, długoterminowe dane dotyczące bezpieczeństwa ani zatwierdzenia regulacyjne dla jakiegokolwiek wskazania. W 2026 r. zarejestrowano badanie fazy 2 dotyczące stosowania wspomagającego z wąskopasmowym UVB w bielactwie. Sprawozdawanie z badań na ludziach nie stanowi wskazówki do stosowania materiału badawczego w ten sposób. Wszystkie materiały Rierink Compounds są przeznaczone wyłącznie do badań laboratoryjnych i nie są lekami.

Wszelkie omawiane informacje i produkty są przeznaczone wyłącznie do użytku laboratoryjnego i badawczego. Nie do stosowania u ludzi ani do użytku weterynaryjnego. Nie są przeznaczone do diagnozowania, leczenia, wyleczenia ani zapobiegania jakiejkolwiek chorobie.



Farmakologia receptorowa in vitro Melanotan II.

Tożsamość chemiczna i kontekst katalogowy

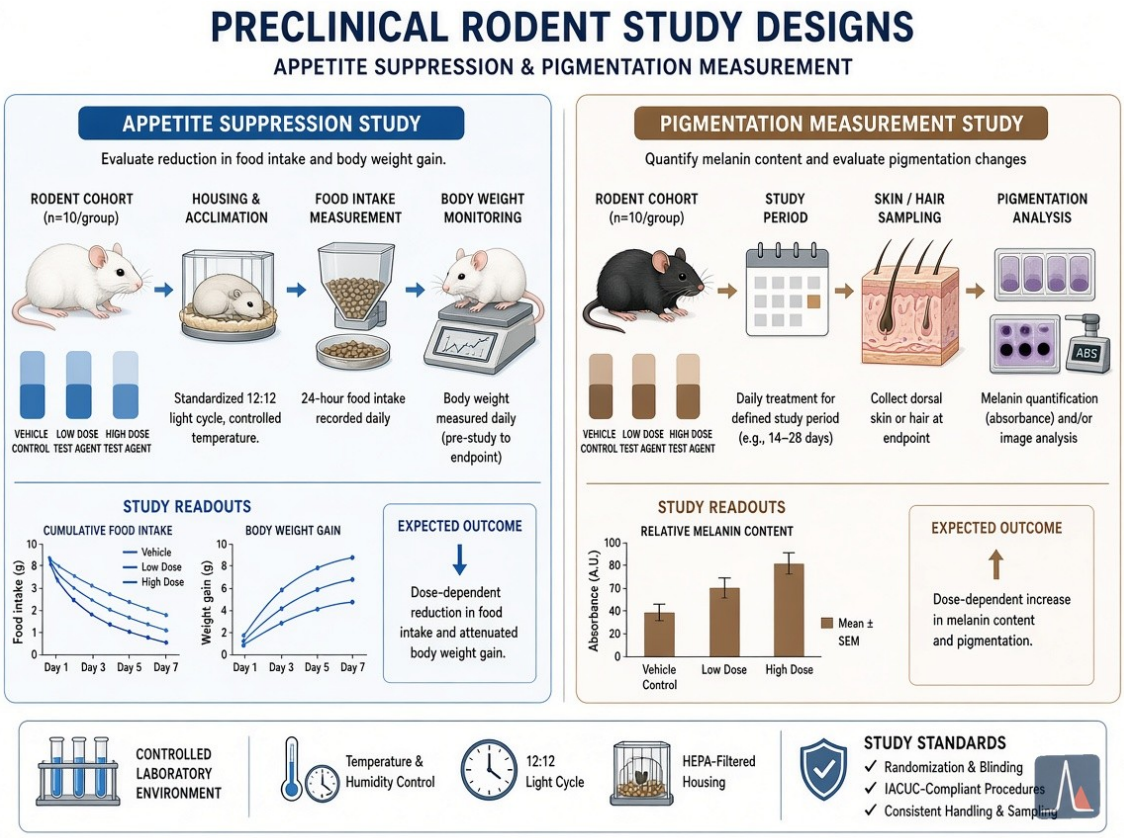
Melanotan II jest konformacyjnie ograniczonym cyklicznym heptapeptydem z mostkiem laktamowym, analogiem hormonu stymulującego melanocyty α (α-MSH), zaprojektowanym w celu poprawy stabilności metabolicznej i siły działania względem natywnego peptydu złożonego z 13 aminokwasów. Struktura obejmuje podstawienie Nle4, mostek laktamowy między Asp5 a Lys10 oraz rdzeniowy farmakofor His6-D-Phe7-Arg8-Trp9, który nadaje superpotencję wobec receptorów melanokortynowych. Działa jako nieselektywny agonista o najwyższym powinowactwie do MC1R (pigmentacja) i istotnej aktywności wobec MC3R, MC4R (ośrodkowa regulacja apetytu i funkcji seksualnych) oraz MC5R. Profil ten odróżnia go od bardziej selektywnego wobec MC1R Melanotan I (afamelanotide), który uzyskał zatwierdzenie regulacyjne w erytropoetycznej protoporfirii. W katalogu Rierink Melanotan II jest oferowany wraz z pokrewnymi narzędziami badawczymi i analogami melanokortynowymi, takimi jak PT-141, wykwalifikowanym badaczom laboratoryjnym badającym farmakologię receptorów, szlaki pigmentacji lub sygnalizację neuroendokrynną. Nie jest przeznaczony do podawania ludziom ani zwierzętom.

Fundamentalne odkrycie, farmakologia receptorowa oraz mechanistyczne badania in vitro (publikacje in_vitro i metodyczne, 1989–2010)

Związek zaprojektowano i zsyntetyzowano w laboratoriach Hruby i Hadley na University of

Wszelkie omawiane informacje i produkty są przeznaczone wyłącznie do użytku laboratoryjnego i badawczego. Nie do stosowania u ludzi ani do użytku weterynaryjnego. Nie są przeznaczone do diagnozowania, leczenia, wyleczenia ani zapobiegania jakiejkolwiek chorobie.

Arizona w ramach programu mającego na celu uzyskanie superpotentnych, enzymatycznie stabilnych analogów α-MSH. Wczesne publikacje metodyczne (koniec lat 80. XX w.–lata 90. XX w.) opisywały syntezy w fazie roztworowej i na fazie stałej, strategie cyklizacji laktamowej oraz zależności struktura–aktywność, które wskazały podstawienie D-Phe7 oraz ograniczenie cykliczne jako kluczowe dla zwiększonej potencji i czasu działania. Badania in vitro z użyciem biotestów na skórze żaby, hodowli melanocytów ssaczych oraz transfekowanych linii komórkowych (CHO, HEK293) wykazujących ekspresję ludzkich receptorów melanokortynowych wykazały nanomolowe do subnanomolowych powinowactwa wiązania (Ki 0.67 nM wobec hMC1R, 6.6 nM wobec hMC4R) oraz potencjał czynnościowy w testach akumulacji cAMP i wytwarzania melaniny, przewyższający natywny α-MSH w przypadku kilku podtypów. Kolejne publikacje udoskonalały protokoły wiązania radioligandów, badały sygnalizację dalszą (aktywacja tyrozynazy, transkrypcja MITF) oraz porównywały profile selektywności wobec pięciu podtypów MCR. Te podstawowe badania in vitro i metodyczne ugruntowały MT-II jako cenne narzędzie farmakologiczne do analizy biologii melanokortyn, lecz jednocześnie uwydatniły brak selektywności receptorowej w porównaniu z późniejszymi analogami. Na podstawie samej farmakologii receptorowej opartej na komórkach nie można wyciągać wniosków dotyczących bezpieczeństwa ani skuteczności u człowieka.

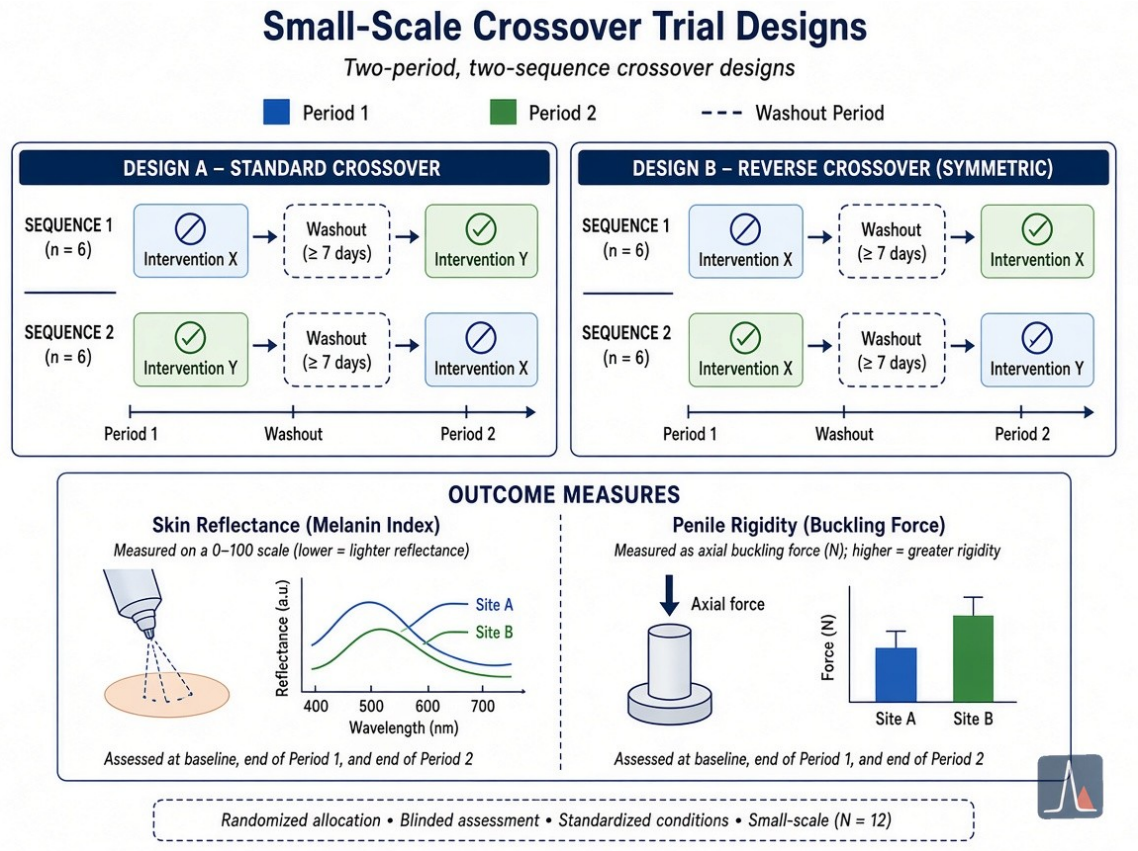


Przedkliniczne modele melanogenezy i zachowań związanych z przyjmowaniem pokarmu.

Przedkliniczne modele zwierzęce melanogenezy, regulacji apetytu, zachowań seksualnych i innych efektów (publikacje na zwierzętach, lata 90. XX w.–2026)

Wszelkie omawiane informacje i produkty są przeznaczone wyłącznie do użytku laboratoryjnego i badawczego. Nie do stosowania u ludzi ani do użytku weterynaryjnego. Nie są przeznaczone do diagnozowania, leczenia, wyleczenia ani zapobiegania jakiejkolwiek chorobie.

Modele gryzoni i inne modele zwierzęce szeroko scharakteryzowały MT-II. W testach pigmentacji podanie podskórne lub ośrodkowe indukowało wytwarzanie eumelaniny i widoczne ciemnienie u szczepów o jasnej skórze bez ekspozycji na promieniowanie ultrafioletowe, zgodnie z agonizmem MC1R. Badania żywieniowe w wielu paradygmatach (na czczo, indukowane neuropeptydem Y, ob/ob, otyłość indukowana dietą) konsekwentnie wykazywały ostre zmniejszenie spożycia pokarmu i masy ciała, mediowane przede wszystkim przez ośrodkowy MC4R; w części doniesień odnotowano zwiększony wydatek energetyczny i termogenezę brunatnej tkanki tłuszczowej, choć szybka tachyfilaksja (tolerancja w ciągu dni) często ograniczała skuteczność przewlekłą. Modele zachowań seksualnych u samców szczurów wykazały efekty proprerekcyjne za pośrednictwem jądra przykomorowego i dróg rdzeniowych, w niektórych paradygmatach niezależnie od tlenku azotu; badania na samicach szczurów wykazały nasilenie zachowań proceptywnych (podskoki, zrywy, poruszanie uszami) po przygotowaniu hormonalnym. Dodatkowe prace na zwierzętach dotyczyły właściwości neuroprotekcyjnych w modelach zmiażdżenia nerwu, poprawy pamięci w paradygmatach diety wysokotłuszczowej oraz łagodzenia cech podobnych do autyzmu w modelach aktywacji immunologicznej matki. Badanie z 2020 r. doniosło, że miejscowo stosowany MT-II hamował progresję czerniaka B16-F10 u myszy poprzez zależne od MC1R zwiększenie ekspresji PTEN i hamowanie COX-2. Te ustalenia przedkliniczne ilustrują zakres fizjologii melanokortyn, lecz nie mogą być bezpośrednio ekstrapolowane na człowieka; wiele efektów (zwłaszcza metabolicznych) wykazuje zależność od gatunku lub kontekstu, a badania długoterminowe są ograniczone. Teoria sugeruje, że utrzymany agonizm MC4R mógłby w sposób prawdopodobny wpływać na bilans energetyczny człowieka, pozostaje to jednak niezweryfikowane w kontrolowanych warunkach klinicznych.



Wczesne pilotażowe badania z udziałem ludzi oraz badania zaburzeń erekcji.

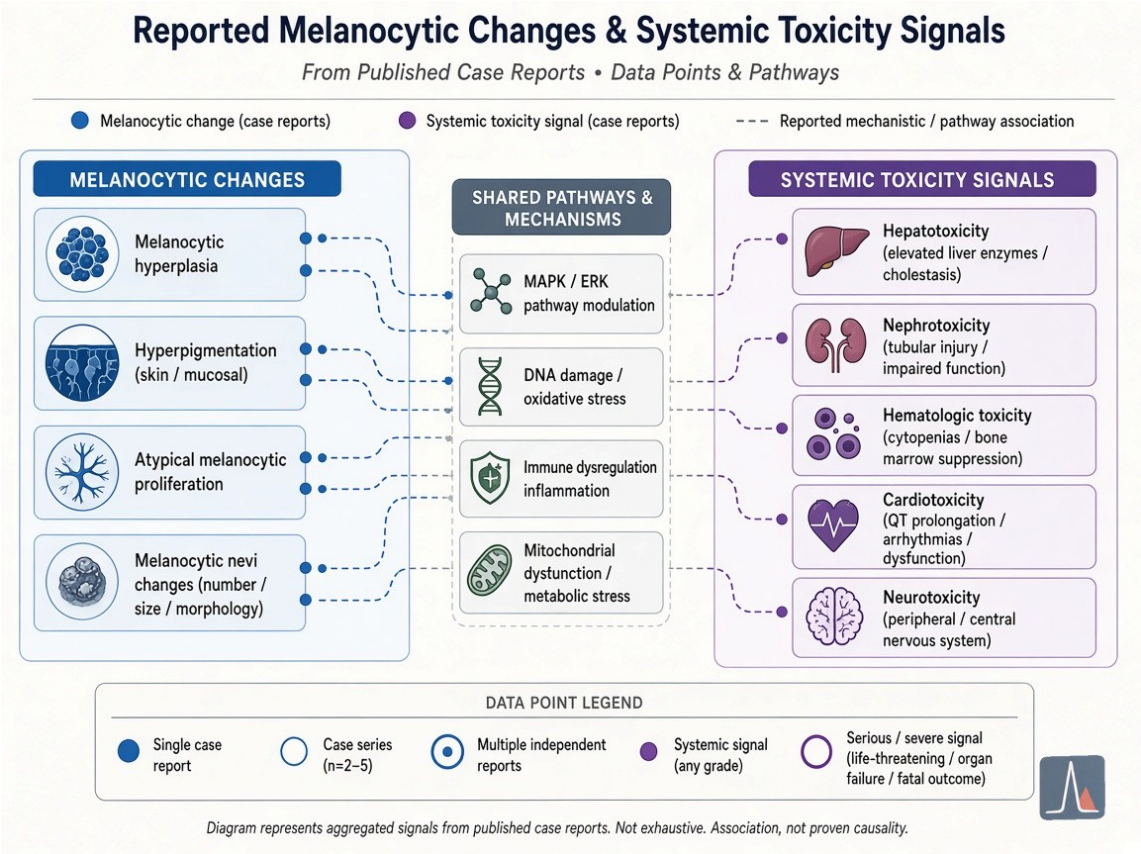
Wszelkie omawiane informacje i produkty są przeznaczone wyłącznie do użytku laboratoryjnego i badawczego. Nie do stosowania u ludzi ani do użytku weterynaryjnego. Nie są przeznaczone do diagnozowania, leczenia, wyleczenia ani zapobiegania jakiejkolwiek chorobie.

Wczesne pilotażowe badania u ludzi oraz randomizowane badania krzyżowe dotyczące opalania i zaburzeń erekcji (prace kliniczne, 1996–2000)

Dane dotyczące ludzi ograniczają się do trzech niewielkich badań grupy z Arizony. W pojedynczo zaślepionym badaniu pilotażowym z 1996 r. (n=3 zdrowych mężczyzn) podawano podskórnie MT-II w eskalowanych dawkach (0.01–0.03 mg/kg) co drugi dzień przez dwa tygodnie. U dwóch z trzech osób badanych stwierdzono mierzalny wzrost pigmentacji skóry (twarz, górna część ciała, pośladki) metodą spektrofotometrii odbiciowej oraz oceny wzrokowej tydzień po ostatniej dawce, bez celowej ekspozycji na UV. Działania niepożądane obejmowały łagodne nudności przy większości dawek, charakterystyczną reakcję ziewania i przeciągania się, spontaniczne erekcje prącia trwające 1–5 godzin oraz senność/zmęczenie przy najwyższej dawce u jednej osoby. Autorzy uznali, że MT-II może indukować opaleniznę po niewielu niskich dawkach, i zalecili 0.025 mg/kg do dalszej oceny.

W dwóch kolejnych podwójnie zaślepionych, kontrolowanych placebo badaniach krzyżowych (łącznie ~20 mężczyzn z czynnikami ryzyka psychogennych lub organicznych zaburzeń erekcji) oceniano 0.025 mg/kg MT-II podawanego podskórnie z zastosowaniem monitorowania RigiScan w czasie rzeczywistym. W badaniu psychogennych zaburzeń erekcji z 1998 r. (n=10) klinicznie widoczne erekcje wystąpiły u 8 z 10 mężczyzn podczas leczenia aktywnego wobec wartości bliskich zeru przy placebo; średni czas sztywności żołędzi >80% wyniósł 38 minut wobec 3 minut (p=0.0045). W badaniu z 2000 r. u mężczyzn z organicznymi czynnikami ryzyka oraz w analizach zbiorczych zgłaszano erekcje po 12 z 19 wstrzyknięć wobec 1 z 21 dawek placebo, przy zwiększonym subiektywnym pożądaniu seksualnym (68% vs 19% dawek). Nudności i ziewanie zgłaszano częściej przy MT-II; ciężkie nudności wystąpiły po około 13% dawek aktywnych w jednej analizie. W tych nadzorowanych warunkach nie odnotowano poważnych zdarzeń niepożądanych wymagających interwencji. Badania te dostarczyły podstawowego dowodu koncepcji dotyczącego udziału ośrodkowego układu melanokortynowego w motywacji seksualnej u ludzi i potwierdziły potencjał opalający, lecz były ograniczone przez bardzo małe próby, udział wyłącznie mężczyzn, krótki czas trwania oraz brak punktów końcowych dotyczących ochrony przed UV lub metabolizmu. Bezpośrednio wpłynęły na program modyfikacji strukturalnej, w wyniku którego powstał bremelanotide.

Wszelkie omawiane informacje i produkty są przeznaczone wyłącznie do użytku laboratoryjnego i badawczego. Nie do stosowania u ludzi ani do użytku weterynaryjnego. Nie są przeznaczone do diagnozowania, leczenia, wyleczenia ani zapobiegania jakiejkolwiek chorobie.



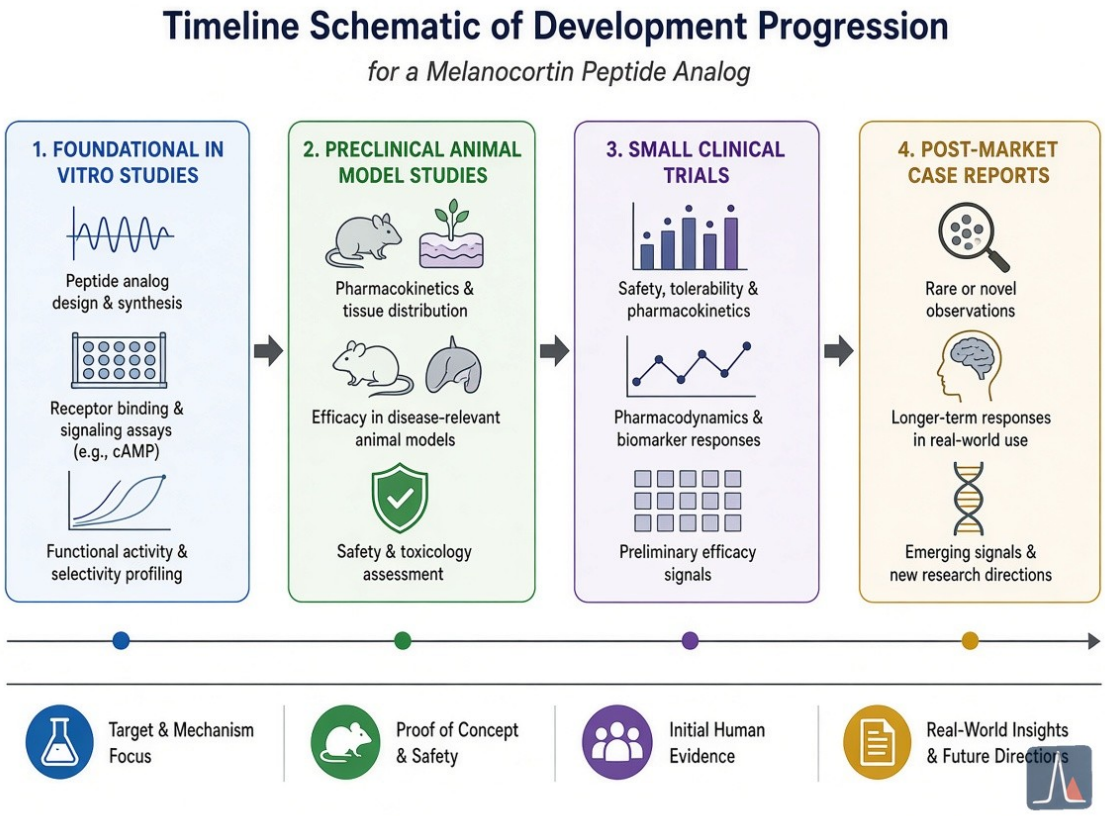
Związki zdarzeń niepożądanych w opublikowanych doniesieniach.

Opisy przypadków niepożądanych zdarzeń dermatologicznych, melanocytarnych i ogólnoustrojowych w następstwie nieregulowanego stosowania (opisy przypadków, 2012–2026)

Po wczesnych badaniach nieregulowany, pozyskiwany z internetu MT-II (postać do wstrzykiwań lub donosowa) wiązano z licznymi opublikowanymi opisami przypadków. Powtarzające się tematy obejmują szybkie ciemnienie lub pojawianie się nowych i atypowych znamion, przetrwałą hiperpigmentację błony śluzowej jamy ustnej lub dziąseł oraz kilka przypadków czerniaka (in situ lub inwazyjnego) powstającego w istniejących znamionach, niekiedy u młodych pacjentów przy jednoczesnym intensywnym korzystaniu z solarium. Przeglądy dermatologiczne (w tym synteza z 2017 r.) skatalogowały co najmniej cztery przypadki czerniaka powiązane czasowo z peptydami melanotan, zaznaczając, że choć stymulacja melanocytów za pośrednictwem MC1R zapewnia biologiczną wiarygodność, ostateczne ustalenie związku przyczynowego jest trudne z uwagi na zakłócające zachowania polegające na poszukiwaniu ekspozycji na UV oraz czynniki genetyczne. Inne doniesienia opisują priapizm wymagający interwencji w trybie nagłym, toksyczność sympatykomimetyczną z rabdomiolizą i ostrym uszkodzeniem nerek po wstrzyknięciu wysokiej dawki, zawał nerki oraz zespół tylnej odwracalnej encefalopatii. Badania analityczne zajętych lub przekazanych przez pacjentów fiolek często ujawniają zanieczyszczenia, nieprawidłowe dawkowanie lub agregację, które mogą nasilać immunogenność lub toksyczność. Opisy te odzwierciedlają rzeczywiste samodzielne eksperymentowanie, a nie stosowanie nadzorowane, i nie pozwalają określić ilościowo częstości występowania; mimo to stanowią dominujące

Wszelkie omawiane informacje i produkty są przeznaczone wyłącznie do użytku laboratoryjnego i badawczego. Nie do stosowania u ludzi ani do użytku weterynaryjnego. Nie są przeznaczone do diagnozowania, leczenia, wyleczenia ani zapobiegania jakiejkolwiek chorobie.

piśmiennictwo kliniczne po 2000 r. i skłoniły organy ochrony zdrowia do ostrzeżeń regulacyjnych dotyczących nielicencjonowanych środków opalających.



Przegląd opublikowanych typów badań i ustaleń dotyczących Melanotan II.

Syntezy dowodów, kontekst regulacyjny, trwające badania i powtarzające się ograniczenia (prace przeglądowe i rejestrowe, 2006–2026)

Przeglądy systematyczne i narracyjne konsekwentnie odnotowują nieliczne wysokiej jakości dane dotyczące ludzi, poleganie na niewielkich badaniach z lat 90. XX wieku przeprowadzonych przez jedną grupę, brak programów fazy 3 oraz brak długoterminowych ocen bezpieczeństwa lub skuteczności w odniesieniu do opalania, kontroli masy ciała lub fotoprotekcji. Pozycjonują MT-II jako ważny historyczny związek narzędziowy, który rozjaśnił szlaki melanokortynowe w funkcji seksualnej i bilansie energetycznym, lecz podkreślają jego nieselektywność oraz potencjał wywoływania nudności jako powody obniżenia priorytetu klinicznego na rzecz środków selektywnych wobec MC1R (afamelanotide) lub ukierunkowanych na MC4R. Dokumenty regulacyjne wymieniają MT-II wśród niezatwierdzonych peptydów z udokumentowanymi sygnałami dotyczącymi bezpieczeństwa; agencje wydały ostrzeżenia dotyczące ryzyka czerniaka, zanieczyszczenia produktu oraz nielegalnego marketingu do celów kosmetycznych. Najnowsze syntezy dotyczące nieregulowanych peptydów „biohacking” powtarzają te obawy i odnotowują analityczne dowody zmiennej czystości. Badanie fazy 2 zarejestrowane w 2026 r. (szacowane n 60)ocenia MT-II w skojarzeniu z wąskopasmowym UVB w porównaniu z samym UVB w stabilnym niesegmentowym bielactwie — pierwsze nowe interwencyjne badanie z udziałem

Wszelkie omawiane informacje i produkty są przeznaczone wyłącznie do użytku laboratoryjnego i badawczego. Nie do stosowania u ludzi ani do użytku weterynaryjnego. Nie są przeznaczone do diagnozowania, leczenia, wyleczenia ani zapobiegania jakiejkolwiek chorobie.

ludzi od dekad. Powtarzające się ograniczenia w literaturze obejmują wczesne badania prowadzone wyłącznie u mężczyzn, krótki okres obserwacji, czynniki zakłócające w opisach przypadków, szybką tolerancję w modelach metabolicznych oraz brak nowoczesnych randomizowanych badań o odpowiedniej mocy statystycznej z obiektywnymi punktami końcowymi dermatologicznymi, metabolicznymi lub dotyczącymi bezpieczeństwa. Choć dane przedkliniczne pozostają obszerne, a wnioski mechanistyczne wartościowe, translacyjna podstawa dowodowa dotycząca zastosowania u ludzi jest wąska i ograniczona przez udokumentowane ryzyka.

Opublikowany dorobek dotyczący Melanotan II ilustruje zatem zarówno naukową użyteczność agonistów melanokortyny jako narzędzi badawczych, jak i istotne luki, które pozostają, zanim jakiekolwiek potencjalne wyniki laboratoryjne mogłyby stanowić podstawę regulowanego rozwoju terapeutycznego. Przyszłe dobrze zaprojektowane badania musiałyby uwzględniać selektywność, tolerancję, długoterminowe bezpieczeństwo melanocytów oraz rygorystyczną charakterystykę produktu.

Źródła

• 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.
• Dodatkowe prace dotyczące wiązania, badania na zwierzętach, opisy przypadków i prace przeglądowe zidentyfikowane w wyszukiwaniach PubMed/Europe PMC (lata 90. XX wieku–2026).

Wszelkie omawiane informacje i produkty są przeznaczone wyłącznie do użytku laboratoryjnego i badawczego. Nie do stosowania u ludzi ani zwierząt. Nie są przeznaczone do diagnozowania, leczenia, wyleczenia ani zapobiegania jakiejkolwiek chorobie.