

Loperamide HCl ; 盐酸洛哌丁胺

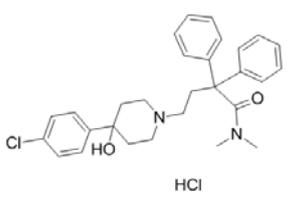
产品编号：MB1460

质量标准：>98%，BR

包装规格：1G；5G

产品形式：白色或类白色结晶性粉末

基本信息：

分子式	C ₂₉ H ₃₃ ClN ₂ O ₂ ·HCl	结 构 式	
分子量	513.50		
CAS No.	34552-83-5		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 22 mg/ml		
	Ethanol : 4mg/ml		
	Water : Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：盐酸洛哌丁胺 Loperamide 盐酸盐是阿片类受体激动剂，是长效止泻剂。

别名：洛哌丁胺 盐酸盐;

4-(p-Chlorophenyl)-4-hydroxy-N,N-dimethyl- α,α -diphenyl-1-piperidinebutyramide
hydrochloride;Loperamide

物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色结晶性粉末

熔点：.....223 °C (lit.)

溶解性：.....DMSO : 22 mg/ml ; Ethanol : 4mg/ml ; Water : Insoluble

干燥失重：..... \leq 0.5%

含量：.....>98%

IC₅₀ :NPY2-R: IC₅₀ = >35 μ M (人); NPY1-R: IC₅₀ = >35 μ M (人)

.....半数致死剂量 (LD₅₀) 经口 - 大鼠 - 185 mg/kg

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Loperamide HCl 是一种阿片受体激动剂，ED ₅₀ 为 0.15 mg/kg。
靶点	μ -opioid receptor, 3.3nM(Ki); δ -opioid receptor, 48nM(Ki)
体外研究	与人的阿片受体 delta (Ki = 48 nM)和 kappa (Ki = 1156 nM)相比，Loperamide 表现对 micro 受体的高亲和力。在转染了人阿片受体的中国仓鼠卵巢细胞中，Loperamide 高效刺激结合[³⁵ S]鸟苷 5'-O-(3-硫代)三磷酸，EC ₅₀ 为 56 nM，并抑制 forskolin 刺激的 cAMP 累积 (IC ₅₀ = 25 nM)。Loperamide 在 intrapaw 注射后有效抑制福尔马林诱导退缩的晚期阶段。Loperamide 是 CES2 的强抑制剂，Ki 为 1.5 μ M，但它只能微弱抑制 CES1A1 (IC ₅₀ = 0.44 mM)。与人的阿片受体 delta (Ki = 48 nM)和 kappa (Ki = 1156 nM)相比，Loperamide 以浓度依赖的方式可逆阻断[K ⁺] _o 诱发的[Ca ²⁺] _i 的上升，IC ₅₀ 为 0.9 mM。Loperamide (0.1-50 mM) 浓度依赖性降低 IBA 峰值，IC ₅₀ 为 2.5 mM。在试验的最高浓度，Loperamide 在没有任何其它药

	理学试剂时充分阻止 I _{Ba} 。在膜电位为-60 毫伏时 ,Loperamide 也衰减 NMDA 诱发的电流 IC ₅₀ 为 73 mM。
体内研究	在小鼠局部胫骨肿瘤 (7.5-75 毫克) 或颈部 (4 毫克/千克) 的毛皮下 ,Loperamide , 阿片样激动剂无法穿越血-脑屏障 , 皮下注射时同时抑制热和机械痛觉过敏。

美仑相关产品推荐

MB1460-S	Loperamide HCl(标准品)
MB21185	N-去甲基洛哌丁胺-d3
MB21186	洛哌丁胺盐酸盐-d6

用途及描述 : 科研试剂 , 广泛应用于分子生物学 , 药理学等科研方面 , 严禁用于人体。本品化学结构类似氟哌啶醇和哌替啶 , 但治疗量对中枢神经系统无任何作用。对肠道平滑肌的作用与阿片类相似。可抑制肠道平滑肌的收缩 , 减少肠蠕动。还可减少肠壁神经末梢释放乙酰胆碱 , 通过胆碱能和非胆碱能神经元局部的相互作用 , 直接抑制蠕动反射。本品可延长食物在小肠的停留时间 , 促进水、电解质及葡萄糖的吸收 , 抑制前列腺素、霍乱毒素和其他肠毒素引起的肠过度分泌。此外 , 本品还可增加肛门括约肌的张力 , 可抑制大便失禁或便秘。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9474mL	9.7371mL	19.4742mL
5 mM	0.3895mL	1.9474mL	3.8948mL
10 mM	0.1947mL	0.9737mL	1.9474mL
50 mM	-	-	-

【注意】

- 我司产品为非无菌包装 , 若用于细胞培养 , 请提前做预处理 , 除去热原细菌 , 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息 , 我司不保证所提供信息的权威性 , 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。