

## 氯雷他定 ; Loratadine

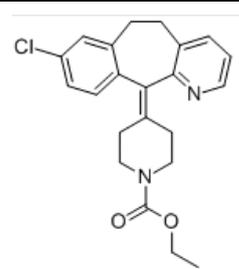
产品编号 : MB1474

质量标准 : &gt;99%

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	C22H23ClN2O2	结构式	
分子量	382.89		
CAS No.	79794-75-5		
储存条件	常温, 防潮密闭避光		
溶解性 (25°C)	DMSO : 17 mg/mL (44.4 mM) Water : Insoluble Ethanol : 76 mg/mL (198.49 mM)		
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 :** Loratadine 是一种选择性的 histamine H1 receptor 拮抗剂, 用于治疗过敏。同时还是一种选择性的 B(0)AT2 抑制剂, 其 IC50 为 4 μM。

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色或类白色结晶性粉末

熔点 : .....132-137°C

溶解性 : .....DMSO : 17 mg/mL (44.4 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 76 mg/mL (198.49 mM)

 密度 : .....1.26 g/cm<sup>3</sup> (预测)

干燥失重 : .....≤0.5%

含量 : .....≥98.5%

IC50 : .....CYP2C19: IC50 = 16 nM (人); HERG: IC50 = 169.82 nM (人);

.....组胺 H1 受体 : IC50 = 170 nM (人); SR-2B: IC50 = 245 nM (人);

.....H1 组胺诱导的猪回肠收缩 : IC50 = 290 nM (猪)

.....半数致死剂量 (LD50) 经口 - 大鼠 - &gt; 5,000 mg/kg

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Loratadine 是一种选择性的 <b>histamine H1 receptor</b> 拮抗剂, 用于治疗过敏。同时还是一种选择性的 <b>B(0)AT2</b> 抑制剂, 其 <b>IC50</b> 为 4 μM。	
<b>靶点</b>	H1 receptor	B(0)AT2
<b>体外研究</b>	Loratadine 被确定为 B(0)AT 2 的选择性抑制剂, IC 50 为 4 μM, 对 SLC6 家族的几个其它成员低活性或无活性。在 Der p 1 和或抗 Fc 小量 RI 预培养的人 Fc 小量的 RI+细胞, Loratadine 浓度依赖性抑制组胺和白三烯 C4 的释放。在抗 Fc 小量 RI 激活的纯化 HLMC 中, Loratadine ( 0.1 mM ) 也抑制组胺, 白三烯 C4 和 PGD2 的释放。在抗 Fc 小量 RI 刺激的纯化 HSMC 中, Loratadine 浓度依赖性抑制组胺, 类胰蛋白酶, LTC4 和 PGD 2 的释放。在人脐静脉内皮细胞, Loratadine	

显著抑制组胺诱导的 IL-6 和 IL-8 的分泌。在转染了 hKv1.5 通道基因的人 Ltk-细胞中，Loratadineh 在浓度高于治疗性血浆水平时以浓度，电压，时间和使用依赖性的方式阻断 Kv1.5 通道。在主支气管或转化(A549)呼吸道上皮细胞中，Loratadineh 抑制 rhinovirus 诱导的 ICAM-1 的上调。Loratadineh 也以剂量依赖的方式抑制鼻病毒感染诱导的 ICAM-1 的 mRNA，并且它们完全抑制鼻病毒诱导的 ICAM-1 启动子的活化。

**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。本品属长效三环类抗组胺药，竞争性地抑制组胺 H1 受体，抑制组胺所引起的过敏症状。本品无明显的抗胆碱和中枢抑制作用。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.6118 mL	13.0589 mL	26.1178 mL
5 mM		0.5224 mL	2.6118 mL	5.2236 mL
10 mM		0.2612 mL	1.3059 mL	2.6118 mL
50 mM		0.0522 mL	0.2612 mL	0.5224 mL

**【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。