

## 脱羧氯雷他定；地氯雷他定；Desloratadine

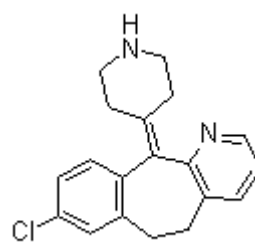
产品编号：MB1535

质量标准：&gt;98%

包装规格：1G; 5G

产品形式：白色或类白色粉末

### 基本信息

分子式	C19H19ClN2	结构式	
分子量	310.82		
CAS No.	100643-71-8		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 26 mg/mL (83.64 mM) Water : Insoluble Ethanol : 62 mg/mL (199.47 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。		

### 物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色粉末

熔点：.....150-151.1°C

溶解性：.....DMSO :26 mg/mL (83.64 mM) ;Water :Insoluble ;Ethanol :62 mg/mL (199.47 mM)

 密度：.....~1.2 g/cm<sup>3</sup> (预测)

IC50：.....组胺 H1 受体：IC50 = 9.98 nM (人); SR-2C: IC50 = 30 nM (人);

.....SR-2A: IC50 = 33 nM (人); SR-2B: IC50 = 43 nM (人);

.....mAChR (毒蕈碱型乙酰胆碱受体) M2: IC50 = 107 nM (人)

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Desloratadine 是一种有效的人组胺 H1 受体拮抗剂， <b>IC50</b> 为 51nM.		
<b>特性</b>	Desloratadine 是 loratadine 的活性代谢物。		
<b>靶点</b>	<table border="1" style="width: 100%;"> <tr> <td>Histamine H1 receptor</td> </tr> <tr> <td>51 nM</td> </tr> </table>	Histamine H1 receptor	51 nM
Histamine H1 receptor			
51 nM			
<b>体外研究</b>	Desloratadine 是卡巴胆碱诱导的离体兔虹膜平滑肌收缩的竞争性拮抗剂，pA <sub>2</sub> 为 6.67。Desloratadine 与人 H1 受体结合，在氘标记的美吡拉敏中，K <sub>i</sub> 值为 0.87 nM。Desloratadine (100 nM 到 10 μM) 抑制 IgE 介导的和非 IgE 介导的人嗜碱粒细胞中细胞因子 IL-4 和 IL-13 的产生。Desloratadine (300 nM 到 100 μM) 抑制 IgE 介导的和非 IgE 介导的组胺从人周边血液嗜碱性粒细胞的释放。在从过敏性鼻炎或过敏性哮喘患者体内取得的嗜酸细胞中，Desloratadine (0.1 μM 到 10 μM) 能够抑制血小板激活因子诱导的嗜伊红性趋药性和 TNF-α 诱导的嗜酸性细胞粘附。Desloratadine (1 μM-10 μM) 剂量依赖性抑制组胺和 LTC <sub>4</sub> 从人嗜碱粒细胞中释放。Desloratadine (0.1 μM-10 μM) 剂量依赖性抑制嗜碱粒细胞中 IL-13 分泌。Desloratadine (10 μM) 预处理导致培养的嗜碱粒细胞中诱导的细胞因子大量减少。在培养的嗜碱粒细胞中，		

	Desloratadine (10 μM)预处理引起IL-4 信子与抗 IgE 激活减少大约 80%。Desloratadine (10 μM) 也会抑制组胺和 IL-4 蛋白质分泌到培养的嗜碱粒细胞的上层清夜中。 [ <sup>3</sup> H] Desloratadine 与在 CHO 细胞中表达的人组胺 H1 受体结合, Kd 为 1.1 nM。在竞争性结合研究中, Desloratadine 比 cetirizine, ebastine, fexofenadine, 和 loratadine 分别有效 52, 57, 194, 以及 153 倍。
<b>体内研究</b>	Desloratadine (1 毫克/毫升, 3 毫克/毫升和 10 毫克/毫升)引起豚鼠体内剂量依赖性和持久性瞳孔放大。Desloratadine 抑制小鼠体内组胺诱导的足肿胀, ED50 为 0.15 毫克/千克。Desloratadine 抑制豚鼠体内组胺侵袭上呼吸道引起的血管通透性增加, ED50 为 0.9 微克。Desloratadine (5 毫克/千克)通过破坏有意识小鼠体内的血脑屏障而抑制氧化震颤素诱导的肿瘤。Desloratadine (1.0 毫克/千克)显著抑制毁脑脊髓大鼠体内氧化震颤素诱导的(0.00125 毫克/千克, 0.0025 毫克/千克, 和 0.02 毫克/千克) dP/dt 减少, 由剂量-响应曲线右移指示。

**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。本品为非镇静性的长效三环类抗组胺药, 是氯雷他定的活性代谢物, 可通过选择性地拮抗外周 H1 受体, 缓解过敏性鼻炎或慢性特发性荨麻疹的相关症状。另外, 体外研究结果, 本品可抑制组胺从肥大细胞释放。动物研究提示, 本品不易通过血脑屏障。

#### 储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.2173 mL	16.0865 mL	32.1730 mL
5 mM	0.6435 mL	3.2173 mL	6.4346 mL
10 mM	0.3217 mL	1.6086 mL	3.2173 mL
50 mM	0.0643 mL	0.3217 mL	0.6435 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>动物实验:</b>	<b>Animal Models:</b> 雄性豚鼠 <b>Formulation:</b> 20% 聚乙二醇-300 <b>Dosages:</b> 10 毫克/千克 <b>Administration:</b> 皮下注射
--------------	---

#### 【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。