

## Montelukast sodium ; 孟鲁司特钠

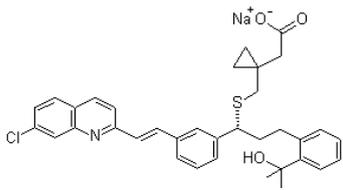
产品编号：MB1795

质量标准：>98%,BR

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	C35H35ClNNaO3S	结构式	
分子量	608.17		
CAS No.	151767-02-1		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 100 mg/mL (164.42 mM) Water : 100 mg/mL (164.42 mM) Ethanol : 100 mg/mL (164.42 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：**孟鲁司特钠 Montelukast sodium 是有效且选择性的 **CysLT<sub>1</sub>**受体拮抗剂。

**别名：**Cyclopropaneacetic acid, Montelukast sodium ; 孟鲁司特钠 ;

1-[[[(1R)-1-[3-[(1E)-2-(7-chloro-2-quinolinyl)ethenyl]phenyl]-3-[2-(1-hydroxy-1-methylethyl)phenyl]propyl]thio]methyl]-

### 物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色粉末

熔点：.....135.5 °C

溶解性：.....DMSO 100 mg/mL (164.42 mM) ; Water : 100 mg/mL (164.42 mM) ; Ethanol : 100 mg/mL (164.42 mM)

含量：.....>98%,

IC50 : .....CysLT1 受体 : IC50 = < 5 nM (人);

.....占替诺盐酸盐-核苷腺苷转移酶 : IC50 = 6.18 μM (金黄色葡萄球菌)

**储存条件：**常温，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Montelukast 选择性拮抗 <b>leukotriene D<sub>4</sub>(LTD<sub>4</sub>)</b> ，通过结合到 CysteinyI leukotriene 受体 CysLT1，从而抑制 Leukotriene D4。
<b>靶点</b>	CysLT1
<b>体外研究</b>	Montelukast 是一种白三烯受体拮抗剂 ( LTRA )，用于哮喘的持续治疗以及缓解季节性过敏症状。Montelukast 通过与肺部和支气管中半胱氨酰白三烯受体 CysLT1 结合而阻断白三烯 D4 的作用，防止气道水肿，平滑肌收缩，以及分泌液粘稠。这减少了由白三烯引起的支气管收缩，并且使炎症较少发生。
<b>体内研究</b>	Montelukast (6 mg/kg, 每天一次，服用 20 天)显著抑制 OVA 激发的小鼠体内 BAL 液和肺组织中增多的嗜酸细胞，并且增加 BAL 液中 IL-5 水平。OVA 激发会增加 CysLT1S 受体但

会减少 CysLT2 受体的 mRNA 表达。OVA 激发后, Montelukast 抑制增加的 CysLT1 但不降低 CysLT2 表达。

**美仑相关产品推荐**

MB1795-S	孟鲁司特钠(标准品)
MB25634	孟鲁司特钠盐-d6
MB25639	酰基孟鲁司特-β-D-葡萄糖苷酸-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。半胱氨酰白三烯(LTC4, LTD4, LTE4)是强效的炎症介质, 由包括肥大细胞和嗜酸性粒细胞在内的多种细胞释放。这些重要的哮喘前介质与半胱氨酰白三烯(CysLT)受体结合。I 型半胱氨酰白三烯(CysLT1)受体分布于人体的气道 (包括气道平滑肌细胞和气道巨噬细胞) 和其他的前炎症细胞 (包括嗜酸性粒细胞和某些骨髓干细胞)。CysLTs 与哮喘和过敏性鼻炎的病理生理过程相关。在哮喘中, 白三烯介导的效应包括一系列的气道反应, 如支气管收缩、粘液分泌、血管通透性增加及嗜酸性粒细胞聚集。在过敏性鼻炎中, 过敏原暴露后的速发相和迟发相反应中, 鼻粘膜均会释放与过敏性鼻炎症状相关的 CysLTs。鼻内 CysLTs 激发会增加鼻部气道阻力和鼻塞的症状。本品是一种能显著改善哮喘炎症指标的强效口服制剂。生物化学和药理学的生物测定显示, 孟鲁司特对 CysLT1 受体有高度的亲和性和选择性 (与其它有药理学重要意义的气道受体如类前列腺素、胆碱和β-肾上腺能受体相比)。孟鲁司特能有效地抑制 LTC4、LTD4 和 LTE4 与 CysLT1 受体结合所产生的生理效应而无任何受体激动活性。目前的研究认为孟鲁司特并不拮抗 CysLT2 受体。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.6443 mL	8.2214 mL	16.4428 mL
5 mM	0.3289 mL	1.6443 mL	3.2886 mL
10 mM	0.1644 mL	0.8221 mL	1.6443 mL
50 mM	0.0329 mL	0.1644 mL	0.3289 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>细胞实验</b>	用胎牛血清(胎牛血清 FBS)刺激鼻粘膜和息肉上皮细胞 24 小时, 用 ELISA 法测定上皮分泌物中的细胞因子浓度。用上皮细胞条件培养基(ECM)培养外周血嗜酸性粒细胞(eosinophil)和孟鲁司(montelukast)培养 3 天后, 用台盼蓝染料排除评估嗜酸性粒细胞存活率。
<b>动物实验</b>	大鼠: 二十四只 SD 大鼠随机分为对照组、哮喘组和孟鲁司特组。采用卵清蛋白(OVA)吸入诱导哮喘大鼠模型。对照组用生理盐水代替致敏液和 1% OVA。孟鲁司特组给药前 2h 给予孟鲁司特(15mg/kg)灌胃 2h。所有大鼠均治疗 8 周。 小鼠: 孟鲁司特溶于 0.5%羧甲基纤维素钠(CMC-NA)中。小鼠随机分为 4 组: (1) 车辆加车辆, (2) Aβ1-42 加载体, (3) Aβ1-42 加孟鲁司特(1 mg/kg), (4) Aβ1-42 加孟鲁司特(2 mg/kg)。溶液通过微量移液管双侧注入脑室。

**【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。