

## Bepotastine besilate ; 苯磺酸贝托司汀

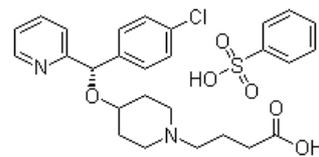
产品编号：MB2065

质量标准：>98.5%

包装规格：100MG;1G;5G

产品形式：白色至淡黄色结晶性粉末

### 基本信息

分子式	C <sub>21</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>3</sub> ·C <sub>6</sub> H <sub>6</sub> O <sub>3</sub> S	结构式	
分子量	547.07		
CAS No.	190786-44-8		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 109 mg/mL (199.24 mM) Water Insoluble Ethanol 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：**苯磺酸贝托司汀 Bepotastine Besilate (Bepreve)是组胺 H1 受体拮抗剂。

**别名：**苯磺酸贝托司汀; 1-Piperidinebutanoic acid, 4-[(S)-(4-chlorophenyl)-2-pyridinylmethoxy]-, benzenesulfonate (1:1)

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至淡黄色结晶性粉末

溶解性：.....DMSO : 109 mg/mL (199.24 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

干燥失重：.....≤1.0%

含量：.....≥98.5%

敏感性：.....对热、光线敏感

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Bepotastine Besilate 是一种非镇静作用的 选择性的 <b>组胺 1 (H1)受体拮抗剂</b> ，pIC <sub>50</sub> 为 5.7。
<b>靶点</b>	Histamine H1 receptor 5.7(pIC <sub>50</sub> )
<b>体外研究</b>	[ <sup>14</sup> C]Bepotastine (5 μM)在 LLC-GA5-COL150 细胞中显著高于在 LLC-PK1 中的通量，表明 LLC-GA5-COL150 细胞中 B-到-A 通量超过另一个方向。Bepotastine 刺激 P-糖蛋白介导的 ATP 水解，K <sub>m</sub> ，V <sub>max</sub> ，和 V <sub>max</sub> /K <sub>m</sub> 分别为 1.25 mM，108 nmol/min/mg 蛋白质，和 0.087 mL/min/mg 蛋白质。在培养的背根神经节神经元和培养的中性粒细胞中，Bepotastine besilate (100 mM)抑制 Leukotriene B(4)诱导的 Ca(2+)浓度。Bepotastine (100 μM)剂量依赖性抑制 LTB <sub>4</sub> 诱导的培养的豚鼠腹膜嗜酸细胞的趋药性。Bepotastine (1

	mM)显著减少培养的大鼠腹腔肥大细胞中 A23187 诱导的组胺释放。
<b>体内研究</b>	Bepotastine (0.8 mg/kg)对 WT 和 P-糖蛋白 KO 小鼠给药 6 分钟后, 血浆中总浓度分别为 580 ng/mL 和 467 ng/mL, 血浆结合蛋白分别为 41.1%和 45.9%。Verapamil 存在或不存在时, [14C]Bepotastine 从近端区域的吸收分别为 63.0%和 72.4%, 从远端区域的吸收分别为 10.9% 和 62.7%。Bepotastine besilate (10 mg/kg)抑制组胺皮内注射(100 nmol/site) 诱导的瘙痒, 但是对血清素(100 nmol/site)无效。Bepotastine besilate (1 mg/kg-10 mg/kg, 口服)剂量依赖性抑 P 物质(100 nmol/site)和白三烯 B(4) (0.03 nmol/site)诱发的瘙痒。Bepotastine besilate 剂量依赖性显著抑制结膜血管通透性增高, 在豚鼠过敏性结膜炎模型中最大作用为 1.5%。Bepotastine (3 mg/kg 和 10 mg/kg)口服给药 1 小时后, 有效抑制 BALB/c 小鼠体内化合物 48/80 诱导的搔痒。过敏性皮炎 NC/Nga 小鼠模型中, Bepotastine (10 mg/kg)也会显著抑制瘙痒, 并抑制血清 LTB(4)水平。

**美仑相关产品推荐**

MB1710	组胺二盐酸盐
MB1710-S	组胺二盐酸盐(标准品)
MB4276	JNJ-7777120

**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。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8280 mL	9.1398 mL	18.2795 mL
5 mM	0.3656 mL	1.8280 mL	3.6559 mL
10 mM	0.1828 mL	0.9140 mL	1.8280 mL
50 mM	0.0366 mL	0.1828 mL	0.3656 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。