

## Lomerizine hydrochloride; 盐酸洛美利嗪

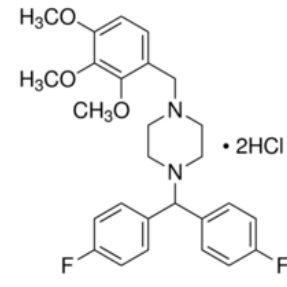
产品编号: MB5711

质量标准: >98%,BR

包装规格: 100MG

产品形式: powder

### 基本信息

分子式	C <sub>27</sub> H <sub>30</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub> ·2(HCl)	结构式	
分子量	541.46		
CAS No.	101477-54-7		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 100 mg/mL warmed (184.68 mM) Water Insoluble Ethanol 52 mg/mL warmed (96.03 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:** 盐酸洛美利嗪 Lomerizine dihydrochloride 是一种双重的 L- 和 T 型电压门控钙通道 (calcium channel) 拮抗剂。

**别名:** KB-2796; **1-[Bis(4-fluorophenyl)methyl]-4-[(2,3,4-trimethoxyphenyl)methyl]piperazine dihydrochloride**

### 物理性状及指标:

外观: .....powder

溶解性: .....DMSO 100 mg/mL warmed (184.68 mM);

Water Insoluble; Ethanol 52 mg/mL warmed (96.03 mM)

含量: .....>98%

**储存条件:** 常温, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	Lomerizine dihydrochloride 是一种相对较新的 L-和 T-型钙通道阻滞剂, 用于治疗偏头痛。	
靶点	L-type calcium channel	T-type calcium channel
体外研究	Lomerizine(0.1 μM 和 1 μM)处理体外培养的大鼠视网膜神经细胞, 显著降低谷氨酸诱导的神经毒性。Lomerizine (1 μM) 处理体外培养的大鼠视网膜神经细胞, 对 N-methyl-D-aspartate	

	和 Kainate 诱导的神经毒性具有保护作用。
体内研究	<p>Lomerizine 按 0.1 mg/kg 和 1 mg/kg 剂量静脉注射处理大鼠视网膜，缺血和再灌注后，立即降低视网膜损伤，这种作用具有剂量依赖性。Lomerizine 按 30 mg/kg 剂量口服处理给药成年 Piebald-Virol-Glaxo (PVG) 大鼠，第 2 周，降低继发性坏死，第 3 周降低 caspase-3 表达。Lomerizine 按 30 mg/kg 剂量口服处理给药雌性 PVG Hooded 大鼠，降低形态破坏，氧化应激，和 Phosphacan 表达，且限制巨噬细胞数目早期增加。Lomerizine 按 30 mg/kg 剂量口服处理给药雌性 PVG Hooded 大鼠，第 4 周，保护 RGCs 免受继发性死亡，但并不能完全恢复行为功能（视动性眼震）。Lomerizine (0.1 mg/kg 或 0.3 mg/kg) 显著增加视网膜和视神经头 (ONH) 中的血流量，但脉络膜或虹膜睫状体中的血流量变化不大。</p> <p>Lomerizine 按 0.1 和 0.3 mg/kg 剂量静脉注射给药兔子，显著增加视神经头中的组织血流量，和睫状后长动脉的血流量，血压 (0.3 mg/kg, 静脉注射) 稍微降低，心率不发生变化。</p> <p>Lomerizine 按 0.1 和 0.3 mg/kg 剂量静脉注射给药兔子，抑制视神经头中的皮下灌注不足。</p>

**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。盐酸洛莫里嗪是一种电压依赖性钙通道阻滞剂和选择性脑血管舒张剂。它是中枢神经系统和脑动脉最具选择性的钙通道阻滞剂之一。据报道，它可以抑制大鼠海马 CA1 锥体神经元的 t 型和 l 型 Ca<sup>2+</sup> 电流，防止谷氨酸诱导的大鼠海马原代细胞神经毒性，并在偏头痛、缺血和缺氧的动物模型中显示保护作用。lomerizine 已被用作偏头痛的一线预防药物。

#### 储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8469 mL	9.2343 mL	18.4686 mL
5 mM	0.3694 mL	1.8469 mL	3.6937 mL
10 mM	0.1847 mL	0.9234 mL	1.8469 mL
50 mM	0.0369 mL	0.1847 mL	0.3694 mL

#### 经典实验操作（仅供参考）

细胞实验	MTT 法用于测定洛美利嗪对阿霉素 (ADM) 细胞毒性的影响。采用流式细胞仪检测洛美利嗪 (3,10 和 30 $\mu$ M) 对 ADM 和长春新碱 (VCR) 诱导的 K562 / ADM 细胞凋亡的影响。通过荧光分光光度法测量 ADM 的细胞内积累。流式细胞术用于研究罗丹明 123 (Rh123) 的外排和 P-糖蛋白 (P-gp) 在 K562 / ADM 细胞中的表达。
动物实验	<p>小鼠 每天 2 小时的 p50 缺陷小鼠和野生型小鼠腹腔内用美金刚 (10mg / kg)，MK-801 (0.5mg / kg)，洛美利嗪 (1mg / kg) 或他克莫司 (2) 进行腹腔内预处理。在 NMDA 注射前一周，0.5 和 0.2mg / kg)。给这些小鼠玻璃体内注射 5nM NMDA，这是引起神经毒性的相对低浓度。</p> <p>大鼠 将体重为 250-350g 的雄性 Wistar 大鼠饲养在 25<math>\pm</math>0<math>^{\circ}</math>C，55<math>\pm</math>5%湿度的空调房间中，随意给予食物和水。洛美利嗪静脉注射。体积为 1 mL / kg 体重。洛美利嗪 (0.3mg / kg, i.v. 或 1mg / kg, i.v.) 的测量对通过激光多普勒血流计 (CBFLDF) 在麻醉大鼠中测量的大脑皮质血流量进行测量。</p>

#### 【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(M <sup>2</sup> )	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, 使产品沉降到管底。对于液体产品, 可以在 200 转左右稍作离心, 管底收集液体, 从而避免损失。产品标签标示重量会有一定误差, 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。