



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Mizolastine**
CAS 号: **108612-45-9**
产品货号: **S80080**

生物活性:				
Description	Mizolastine 是一种口服有效的, 具有高亲和力和特异性的外周组胺 H1 受体拮抗剂 (第二代抗组胺剂)。Mizolastine 能有效抑制 VEGF165、VEGF120、TNF-α 和 KC 的 mRNA 表达。Mizolastine 可用于过敏性鼻炎和慢性特发性荨麻疹的研究。			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HEK293	IC ₅₀	441 nM	Inhibition of human ERG channel expressed in HEK293 cells by patch clamp assay
In Vitro	Mizolastine (1-10000 nM; 0.5-6 h) shows inhibitory effects on VEGF, KC and TNF-α release in mast cells[1].			
	Mizolastine (0.1 μM; 4 h) significantly reduces VEGF165, VEGF120, TNF-α and KC mRNA expression in mast cells[1]。			
	Cell Viability Assay[1]			
	Cell Line:		Mast cells (from Kunming mice)	
	Concentration:		1-10000 nM	
	Incubation Time:		0.5-6 h	
	Result:		Markedly inhibited release of KC, VEGF and TNF-α in a time- and dose- dependent manner.	
	RT-PCR[1]			
	Cell Line:		Mast cells (from Kunming mice)	
	Concentration:		0.1 μM	
	Incubation Time:		4 h	
	Result:		Led to a significant reduction of induced VEGF165, VEGF120, TNF-α and KC mRNA synthesis.	
In Vivo	Mizolastine (0.3 mg/kg; p.o.; single daily for 7 days) inhibits production of 5-LOX AA (arachidonic acid) metabolite leukotriene B4 (LTB4), and suppresses expression of 5-LOX, cytosolic PLA2 (cPLA2), 5-LOX-activating protein, and LTB4 receptor mRNA in the AA-induced inflammation model[2].			
	Animal Model:		Male Sprague-Dawley rats (specific-pathogen-free; 234-254 g; 7 to 8-week-old; rat model)[2].	
	Dosage:		0.3 mg/kg	
	Administration:		Oral gavage; single daily for 7 days.	
	Result:		Significantly reduced paw edema by 21% at 1 h, and by 14- 18% between 2 and 4 h. Inhibited inflammatory cell infiltration and significantly reduced levels of LTB4. Suppressed expression of 5- LOX, cPLA2, FLAP and LTB4r mRNA.	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (57.80 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) H2O 中的溶解度 : < 0.1 mg/mL (insoluble)			



	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.3122 mL	11.5610 mL	23.1219 mL
		5 mM	0.4624 mL	2.3122 mL	4.6244 mL
		10 mM	0.2312 mL	1.1561 mL	2.3122 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限：-80℃, 2 years; -20℃, 1 year。 -80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。 动物实验： 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.78 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.78 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.78 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。					
参考文献	[1]. Xia Q, et al. The effect of mizolastine on expression of vascular endothelial cell growth factor, tumour necrosis factor-alpha and keratinocyte-derived chemokine in murine mast cells, compared with dexamethasone and loratadine. Clin Exp Dermatol. 2005 Mar				



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

- [2]. Ren X, et al. The anti-inflammatory effects of Yunnan Baiyao are involved in regulation of the phospholipase A2/arachidonic acid metabolites pathways in acute inflammation rat model. Mol Med Rep. 2017 Oct;16(4):4045-4053.
- [3]. Prakash A, et al. Mizolastine: a review of its use in allergic rhinitis and chronic idiopathic urticaria. BioDrugs. 1998 Jul;10(1):41-63.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液;一旦配成溶液,请分装保存,避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。 -80°C 储存时,请在 2 年内使用, -20°C 储存时,请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3122 mL	11.5610 mL	23.1219 mL	57.8048 mL
	5 mM	0.4624 mL	2.3122 mL	4.6244 mL	11.5610 mL
	10 mM	0.2312 mL	1.1561 mL	2.3122 mL	5.7805 mL
	15 mM	0.1541 mL	0.7707 mL	1.5415 mL	3.8537 mL
	20 mM	0.1156 mL	0.5780 mL	1.1561 mL	2.8902 mL
	25 mM	0.0925 mL	0.4624 mL	0.9249 mL	2.3122 mL
	30 mM	0.0771 mL	0.3854 mL	0.7707 mL	1.9268 mL
	40 mM	0.0578 mL	0.2890 mL	0.5780 mL	1.4451 mL
	50 mM	0.0462 mL	0.2312 mL	0.4624 mL	1.1561 mL