



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: **BEPOTASTINE**
CAS 号: **125602-71-3**
产品货号: **S82597**

生物活性:

Description	Bepotastine 是一种具有选择性和口服活性的第二代组胺 H1 受体 (histamine H1 receptor) 拮抗剂, 可抑制组胺介导的神经生长因子 (NGF) 表达上调。Bepotastine 可用于过敏性鼻炎, 过敏性结膜炎和荨麻疹/瘙痒症的研究。				
IC50 & Target	H1 Receptor				
In Vitro	Bepotastine (10、100、1000 μM; 预孵育 120 分钟) 减少 A23187 (HY-N6687) 处理诱导的组胺释放, 在 1000 μM 时达到统计学上显著的降低水平[1]。				
	Bepotastine (50 μM; 1 h) 抑制 NHEKs[2] 中 NGF mRNA 的表达。				
	Cell Viability Assay[1]				
	Cell Line:	RPMCs			
	Concentration:	10, 100, 1000 μM			
	Incubation Time:	120 min (preincubate)			
	Result:	Decreased the release of histamine.			
	Western Blot Analysis[2]				
	Cell Line:	NHEKs			
	Concentration:	50 μM (preincubation)			
In Vivo	Bepotastine (10 g/L; 滴眼液; 一只眼睛每隔 20 分钟滴 3 次) 显著抑制 PAF 诱导的结膜嗜酸性粒细胞浸润[1]。				
	Bepotastine (3 mg/kg; 口服; 一次) 抑制抓挠行为的频率为 59.0, 持续时间为 14.57 秒, 与对照相比几乎处于同一水平[3]。				
	Bepotastine (10 mg/kg; 口服; 一次) 显著抑制 NC/Nga 皮疹小鼠的血清 LTB4 水平至 1 小时时的 711.3 pg/mL 和 2 小时时的 858.8 pg/mL[3]。				
	Animal Model:	Guinea pigs (6-week-old)[1].			
	Dosage:	10 g/L (1.0% (w/v)) for 10 μL.			
	Administration:	Eye drop; 3 times at intervals of 20 min (in one eye).			
	Result:	Inhibited PAF-induced conjunctival eosinophil infiltration.			
	Solvent&Solubility	细胞实验:			
		DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (257.14 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 : ≥ 100 mg/mL (257.14 mM)			
* "≥" means soluble, but saturation unknown					
Preparing Stock Solutions		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.5714 mL	12.8571 mL	25.7142 mL
		5 mM	0.5143 mL	2.5714 mL	5.1428 mL
	10 mM	0.2571 mL	1.2857 mL	2.5714 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°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时,请在 6 个月内使用, -20°C 储存时,请在 1 个月内使用。 * 备注:如您选择水作为储备液,请稀释至工作液后,再用 0.22 µm 的滤膜过滤除菌后使用。 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 (6.43 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 (6.43 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 (6.43 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]. Kida T, et al. Bepotastine besilate, a highly selective histamine H(1) receptor antagonist, suppresses vascular hyperpermeability and eosinophil recruitment in in vitro and in vivo experimental allergic conjunctivitis models. Exp Eye Res. 2010 Jul;91(1):85-91. [2]. Kamata Y, et al. Bepotastine besilate downregulates the expression of nerve elongation factors in normal human epidermal keratinocytes. J Dermatol Sci. 2018 Apr 23:S0923-1811(18)30186-5. [3]. Tanizaki H, et al. Oral administration of bepotastine besilate suppressed scratching behavior of atopic dermatitis model NC/Nga mice. Int Arch Allergy Immunol. 2008;145(4):277-82. [4]. Jon I Williams, et al. Non-clinical pharmacology, pharmacokinetics, and safety findings for the antihistamine bepotastine besilate. Curr Med Res Opin. 2010 Oct;26(10):2329-38



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

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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时,请在 6 个月内使用, -20°C 储存时,请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO/ H ₂ O	1 mM	2.5714 mL	12.8571 mL	25.7142 mL	64.2855 mL
	5 mM	0.5143 mL	2.5714 mL	5.1428 mL	12.8571 mL
	10 mM	0.2571 mL	1.2857 mL	2.5714 mL	6.4286 mL
	15 mM	0.1714 mL	0.8571 mL	1.7143 mL	4.2857 mL
	20 mM	0.1286 mL	0.6429 mL	1.2857 mL	3.2143 mL
	25 mM	0.1029 mL	0.5143 mL	1.0286 mL	2.5714 mL
	30 mM	0.0857 mL	0.4286 mL	0.8571 mL	2.1429 mL
	40 mM	0.0643 mL	0.3214 mL	0.6429 mL	1.6071 mL
	50 mM	0.0514 mL	0.2571 mL	0.5143 mL	1.2857 mL
	60 mM	0.0429 mL	0.2143 mL	0.4286 mL	1.0714 mL
	80 mM	0.0321 mL	0.1607 mL	0.3214 mL	0.8036 mL
	100 mM	0.0257 mL	0.1286 mL	0.2571 mL	0.6429 mL

备注: 如您选择水作为储备液,请稀释至工作液后,再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。