



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: **2-(2-METHYLAMINOETHYL)PYRIDINE; Betahistine**
CAS 号: **5638-76-6**
产品货号: **S88135**

生物活性:					
Description	Betahistine 是一种具有口服活性的组胺 H1 受体 (histamine H1 receptor) 激动剂和 H3 受体 (H3 receptor) 的拮抗剂。Betahistine 可以用于类风湿性关节炎 (RA) 的研究。				
IC50 & Target[1]	H1 Receptor		H3 receptor		
In Vitro	Betahistine (0-10 μ M) inhibits [125I]iodoproxyfan binding to membranes of CHO (rH3(445)R) and CHO (hH3(445)R) cells with IC50 values of 1.9 μ M and 3.3 μ M, respectively. Lead to Ki values of 1.4 μ M and 2.5 μ M, respectively[2]. Betahistine (0-10 μ M) has a regulating function on cAMP formation in CHO (rH3(445)R), CHO (rH3(413)R), and CHO (hH3(445)R) cells. At low concentrations, betahistine behaves an apparent inverse agonist, and progressively enhances cAMP formation with EC50 values of 0.1 nM, 0.05 nM and 0.3 nM, respectively. In contrast, at concentrations higher than 10 nM, betahistine inhibits cAMP formation with an EC50 value of 0.1 μ M in CHO (rH3(445)R) and full agonist activity[2]。				
In Vivo	Betahistine (intraperitoneal or oral administration; 0.1-30 mg/kg; single dose) with acute administration has increased tele-methylhistamine (t-MeHA) levels with an ED50 of 0.4 mg/kg, indicating the inverse agonism. Besides, after acute oral administration, it increases t-MeHA levels with an ED50 of 2 mg/kg in male Swissmice[2]. Betahistine (oral administration; 1 and 5 mg/kg; daily for 3 weeks) attenuates the severity of arthritis and reduces the levels of pro-inflammatory cytokines in the paw tissues of CIA mice[3].				
	Animal Model:	Collagen-induced arthritis (CIA) DBA/1 male mouse model[3]			
	Dosage:	1 mg/kg; 5mg/kg			
	Administration:	Oral administration; day 21 to day 42 after a 21-day CIA induction			
	Result:	Ameliorated mouse CIA by decreasing joint destruction.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (734.27 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	7.3427 mL	36.7134 mL	73.4268 mL
		5 mM	1.4685 mL	7.3427 mL	14.6854 mL
10 mM		0.7343 mL	3.6713 mL	7.3427 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。 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 (18.36 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 (18.36 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 (18.36 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]. Poyurovsky M, et al. The effect of betahistidine, a histamine H1 receptor agonist/H3 antagonist, on olanzapine-induced weight gain in first-episode schizophrenia patients. Int Clin Psychopharmacol. 2005 Mar;20(2):101-3. [2]. Gbahou F, et al. Effects of betahistidine at histamine H3 receptors: mixed inverse agonism/agonism in vitro and partial inverse agonism in vivo. J Pharmacol Exp Ther. 2010 Sep 1;334(3):945-54. [3]. Tang KT, et al. Betahistidine attenuates murine collagen-induced arthritis by suppressing both inflammatory and Th17 cell responses. Int Immunopharmacol. 2016 Oct;39:236-245.
------	---

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	1 mM	7.3427 mL	36.7134 mL	73.4268 mL	183.5671 mL
	5 mM	1.4685 mL	7.3427 mL	14.6854 mL	36.7134 mL



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

	10 mM	0.7343 mL	3.6713 mL	7.3427 mL	18.3567 mL
	15 mM	0.4895 mL	2.4476 mL	4.8951 mL	12.2378 mL
	20 mM	0.3671 mL	1.8357 mL	3.6713 mL	9.1784 mL
	25 mM	0.2937 mL	1.4685 mL	2.9371 mL	7.3427 mL
	30 mM	0.2448 mL	1.2238 mL	2.4476 mL	6.1189 mL
	40 mM	0.1836 mL	0.9178 mL	1.8357 mL	4.5892 mL
	50 mM	0.1469 mL	0.7343 mL	1.4685 mL	3.6713 mL
	60 mM	0.1224 mL	0.6119 mL	1.2238 mL	3.0595 mL
	80 mM	0.0918 mL	0.4589 mL	0.9178 mL	2.2946 mL
	100 mM	0.0734 mL	0.3671 mL	0.7343 mL	1.8357 mL



源叶