



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: **Emedastine**

CAS 号: **87233-61-2**

产品货号: **S88203**

生物活性:					
Description	Emedastine 是一种具有口服活性, 选择性和高亲和力的组胺 H1 受体拮抗剂, Ki 值为 1.3 nM。 Emedastine 是一种苯并咪唑衍生物, 具有强大的抗过敏特性, 可用于过敏性鼻炎, 过敏性皮肤疾病和过敏性结膜炎。				
IC50 & Target[1]	H ₁ Receptor 1.3 nM (Ki)	H ₂ Receptor 49067 nM (Ki)	H ₃ Receptor 12430 nM (Ki)		
In Vitro	Emedastine inhibits histamine H2 receptor (Ki=49067 nM) and histamine H3 receptor (Ki=12430 nM)[1]. High concentrations of Emedastine (1 and 10 ng/ml) significantly inhibits type 1 collagen production in normal human dermal fibroblasts[2]. Emedastine (1, 10, 100, 1000 nM) at concentrations of ≥ 10 nM inhibits CC chemokine-elicited eosinophil migration[2]。				
In Vivo	Emedastine (0.03, 0.1, 0.3 mg/kg; orally; pretreatment of 30 min) significantly suppresses histamine-induced scratching with 0.1 and 0.3 mg/kg but not 0.03 mg/kg[3].				
	Pretreatment with Emedastine (0.03, 0.1, 0.3 mg/kg; orally) significantly inhibits the scratching induced by substance P and leukotriene B[3].				
	Emedastine (0.3 mg/kg, p.o.) produces significant inhibition of passive peritoneal anaphylaxis in guinea-pigs[2].				
	Emedastine inhibits histamine-induced contractions of isolated ileum (IC50=6.1 nM)[2]。				
	Animal Model:	Male ICR mice 5-6 weeks of age[3]			
	Dosage:	0.03, 0.1, 0.3 mg/kg			
	Administration:	Orally; 30 min before pruritogen injection			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (413.35 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)				
	Ethanol 中的溶解度 : 100 mg/mL (330.68 mM; 超声助溶)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.3068 mL	16.5338 mL	33.0677 mL
		5 mM	0.6614 mL	3.3068 mL	6.6135 mL
		10 mM	0.3307 mL	1.6534 mL	3.3068 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。-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: ≥ 2.08 mg/mL (6.88 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (6.88 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (6.88 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Sharif NA, et al. Emedastine: a potent, high affinity histamine H1-receptor-selective antagonist for ocular use: receptor binding and second messenger studies. J Ocul Pharmacol. 1994 Winter;10(4):653-64. [2]. Murota H, et al. Emedastine difumarate: a review of its potential ameliorating effect for tissue remodeling in allergic diseases. Expert Opin Pharmacother. 2009 Aug;10(11):1859-67. [3]. Andoh T, et al. Involvement of blockade of leukotriene B(4) action in anti-pruritic effects of emedastine in mice. Eur J Pharmacol. 2000 Oct 6;406(1):149-52.

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。-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	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				
	1 mM	3.3068 mL	16.5338 mL	33.0677 mL	82.6692 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

Ethanol /DMSO	5 mM	0.6614 mL	3.3068 mL	6.6135 mL	16.5338 mL
	10 mM	0.3307 mL	1.6534 mL	3.3068 mL	8.2669 mL
	15 mM	0.2205 mL	1.1023 mL	2.2045 mL	5.5113 mL
	20 mM	0.1653 mL	0.8267 mL	1.6534 mL	4.1335 mL
	25 mM	0.1323 mL	0.6614 mL	1.3227 mL	3.3068 mL
	30 mM	0.1102 mL	0.5511 mL	1.1023 mL	2.7556 mL
	40 mM	0.0827 mL	0.4133 mL	0.8267 mL	2.0667 mL
	50 mM	0.0661 mL	0.3307 mL	0.6614 mL	1.6534 mL
	60 mM	0.0551 mL	0.2756 mL	0.5511 mL	1.3778 mL
	80 mM	0.0413 mL	0.2067 mL	0.4133 mL	1.0334 mL
	100 mM	0.0331 mL	0.1653 mL	0.3307 mL	0.8267 mL

