



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: Tolterodine tartrate
CAS 号: 124937-52-6
产品货号: S41725

生物活性:

Description	Tolterodine Tartrate (Kabi-2234; PNU-200583E) 是一种有效的毒蕈碱受体拮抗剂, 体内对膀胱具有选择性.			
In Vitro	Carbachol-induced contractions of isolated guinea pig bladder were effectively inhibited by tolterodine (IC ₅₀ 14 nM) and 5-HM (IC ₅₀ 5.7 nM). The IC ₅₀ values were in the microM range and the antimuscarinic potency of tolterodine was 27, 200 and 370-485 times higher, respectively, than its potency in blocking histamine receptors, alpha-adrenoceptors and calcium channels. The active metabolite, 5-HM, was >900 times less potent at these sites than at bladder muscarinic receptors[1].			
In Vivo	Tolterodine was extensively metabolized in vivo[2]. In the passive-avoidance test, tolterodine at 1 or 3 mg/kg had no effect on memory; the latency to cross and percentage of animals crossing were comparable to controls. In contrast, scopolamine induced a memory deficit; the latency to cross was decreased, and the number of animals crossing was increased[3].			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (210.27 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) H ₂ O 中的溶解度 : 16.67 mg/mL (35.05 mM; 超声助溶)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.1027 mL	10.5137 mL
		5 mM	0.4205 mL	2.1027 mL
		10 mM	0.2103 mL	1.0514 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 (5.26 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 (5.26 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 (5.26 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]. Nilvebrant L. Tolterodine and its active 5-hydroxymethyl metabolite: pure muscarinic receptor antagonists. Pharmacol Toxicol. 2002 May;90(5):260-7. [2]. Andersson SH, et al. Biotransformation of tolterodine, a new muscarinic receptor antagonist, in mice, rats, and dogs. Drug Metab Dispos. 1998 Jun;26(6):528-35. [3]. Cappon GD, et al. Tolterodine does not affect memory assessed by passive-avoidance response test in mice. Eur J Pharmacol. 2008 Jan 28;579(1-3):225-8.

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	2.1027 mL	10.5137 mL	21.0274 mL	52.5685 mL
	5 mM	0.4205 mL	2.1027 mL	4.2055 mL	10.5137 mL
	10 mM	0.2103 mL	1.0514 mL	2.1027 mL	5.2568 mL
	15 mM	0.1402 mL	0.7009 mL	1.4018 mL	3.5046 mL
	20 mM	0.1051 mL	0.5257 mL	1.0514 mL	2.6284 mL
	25 mM	0.0841 mL	0.4205 mL	0.8411 mL	2.1027 mL
	30 mM	0.0701 mL	0.3505 mL	0.7009 mL	1.7523 mL
DMSO	40 mM	0.0526 mL	0.2628 mL	0.5257 mL	1.3142 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: shyysw@sina.com

	50 mM	0.0421 mL	0.2103 mL	0.4205 mL	1.0514 mL
	60 mM	0.0350 mL	0.1752 mL	0.3505 mL	0.8761 mL
	80 mM	0.0263 mL	0.1314 mL	0.2628 mL	0.6571 mL
	100 mM	0.0210 mL	0.1051 mL	0.2103 mL	0.5257 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 μm 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶