



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

产品名称: **Granisetron**

CAS 号: **109889-09-0**

产品货号: **S88788**

生物活性:				
Description	Granisetron (BRL 43694) 是 5-HT ₃ 受体拮抗剂。			
IC ₅₀ & Target	5-HT ₃ Receptor 17 μM (IC ₅₀)			
In Vitro	In rat forestomach GR reduced 5-HT-evoked contractions at IC ₅₀ 17 /- 6 uM. In isolated rabbit heart, GR 0.003-0.03 nM dose-dependently reduced s-HT tachycardia; at high levels GR reduced submaximal and maximal responses to 5-HT[1].			
In Vivo	Leukocyte accumulation was dose-dependently inhibited by granisetron both at 6 and 72 h after induction of inflammation. Granisetron increased PGE(2) level at a lower dose (50 microg/pouch) but higher doses (100 and 200 microg/pouch) inhibited the release. At the same time, TNFalpha production was decreased by the lower dose and increased by higher doses of granisetron in a reciprocal fashion[2]. The GTDS displayed non-inferiority to oral granisetron: complete control was achieved by 60% of patients in the GTDS group, and 65% in the oral granisetron group (treatment difference, -5%; 95% confidence interval, -13-3). Both treatments were well tolerated, the most common adverse event being constipation[3].			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (80.02 mM); 超声助溶 (<60°C); 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
		1 mM	3.2009 mL	16.0046 mL
		5 mM	0.6402 mL	3.2009 mL
		10 mM	0.3201 mL	1.6005 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: ≥ 2.5 mg/mL (8.00 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 (8.00 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 (8.00 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]. Sanger GJ, Nelson DR. Selective and functional 5-hydroxytryptamine₃ receptor antagonism by BRL 43694 (granisetron). Eur J Pharmacol. 1989 Jan 10;159(2):113-24. [2]. Maleki-Dizaji N, Eteraf-Oskouei T, Fakhrjou A, The effects of 5HT₃ receptor antagonist granisetron on inflammatory parameters and angiogenesis in the air-pouch model of inflammation. Int Immunopharmacol. 2010 Sep;10(9):1010-6. [3]. Boccia RV, Gordan LN, Clark G, Efficacy and tolerability of transdermal granisetron for the control of chemotherapy-induced nausea and vomiting associated with moderately and highly emetogenic multi-day chemotherapy: a randomized, double-blind, phase III.

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 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.2009 mL	16.0046 mL	32.0092 mL	80.0230 mL
	5 mM	0.6402 mL	3.2009 mL	6.4018 mL	16.0046 mL
	10 mM	0.3201 mL	1.6005 mL	3.2009 mL	8.0023 mL
	15 mM	0.2134 mL	1.0670 mL	2.1339 mL	5.3349 mL
	20 mM	0.1600 mL	0.8002 mL	1.6005 mL	4.0012 mL
	25 mM	0.1280 mL	0.6402 mL	1.2804 mL	3.2009 mL
	30 mM	0.1067 mL	0.5335 mL	1.0670 mL	2.6674 mL
	40 mM	0.0800 mL	0.4001 mL	0.8002 mL	2.0006 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

	50 mM	0.0640 mL	0.3201 mL	0.6402 mL	1.6005 mL
	60 mM	0.0533 mL	0.2667 mL	0.5335 mL	1.3337 mL
	80 mM	0.0400 mL	0.2001 mL	0.4001 mL	1.0003 mL



源叶