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：伐诺司林二盐酸盐
产品别名：Vanoxerine dihydrochloride；GBR-12909 dihydrochloride; I893 dihydrochloride

生物活性：

Description	Vanoxerine dihydrochloride (GBR-12909 dihydrochloride) is a competitive, potent, and highly selective dopamine reuptake inhibitor (Ki=1 nM). Vanoxerine dihydrochloride (GBR-12909 dihydrochloride) binds to the target site on the dopamine transporter (DAT)[1].
IC_{50} & Target	Ki: 1 nM (dopamine reuptake)[1]
In Vitro	Vanoxerine dihydrochloride (GBR-12909 dihydrochloride) inhibits the uptake of dopamlne (DA), with an IC50 in the low nanomolar range, and is several-fold less potent as inhibitors of the uptake of noradrenaline and 5-HT[2]. Vanoxerine dihydrochloride (GBR-12909 dihydrochloride) is also an oral, mixed ion channel blocker with IKr, INa, and L-type calcium channel activity[3].
In Vivo	Vanoxerine dihydrochloride (2.5-20 mg/kg; i.p.) significantly increases the ambulatory activity[3].

Animal Model:	Male mice (ddY strain at 6 weeks of age)[3]
Dosage:	2.5, 5, 10, 20 mg/kg
Administration:	Intraperitoneal injection
Result:	The ambulatory activity of mice increased in a dose-dependent manner, with a maximal increase at 30 min after the administration.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : 9.4 mg/mL (17.96 mM; Need ultrasonic and warming)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.9103 mL	9.5513 mL	19.1026 mL
	5 mM	0.3821 mL	1.9103 mL	3.8205 mL
	10 mM	0.1910 mL	0.9551 mL	1.9103 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。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.97 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (3.97 mM，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；

	向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。 2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.97 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (3.97 mM，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。 3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.97 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (3.97 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 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。
References	[1]. Rothman RB, et al. Dopamine transport inhibitors based on GBR12909 and benztropine as potential medications to treat cocaine addiction. Biochem Pharmacol. 2008 Jan 1;75(1):2-16. [2]. Hirate K, et al. Characteristics of the ambulation-increasing effect of GBR-12909, a selective dopamine uptakeinhibitor, in mice. Jpn J Pharmacol. 1991 Apr;55(4):501-11. [3]. Andersen PH. The dopamine inhibitor GBR 12909: selectivity and molecular mechanism of action. Eur J Pharmacol.