

## 盐酸格拉司琼 ; Granisetron HCl

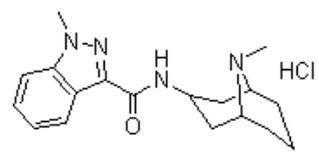
产品编号 : MB1118

质量标准 : >99.0%,BR

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : 白色或类白色粉末

### 基本信息

分子式	C18H24N4O·HCl ; C18H25ClN4O	结构式	
分子量	348.87		
CAS No.	107007-99-8		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 1 mg/mL (2.86 mM) Ethanol 1 mg/mL (2.86 mM) Water 69 mg/mL (197.78 mM) 略溶于二氯甲烷; 微溶于甲醇		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色或类白色粉末

熔点 : .....284.0-290.0°C

溶解性 : .....溶于水 69 mg/mL, 略溶于二氯甲烷、DMSO 1 mg/mL、乙醇 1 mg/mL, 微溶于甲醇

干燥失重 : .....≤0.5%

含量 : .....97.0%~102.0

IC50 : .....NG108-15 : IC50 = 2.8 nM (鼠亚科); 多巴胺 D2 受体 : IC50>1μM(大鼠);

.....血清素 4 (5-HT4)受体 : IC50 >1 μM (荷兰猪); 血清素 3 受体 : IC50 = 1.76 μM (大鼠)

.....半数致死剂量 (LD50) 经口 - 大鼠 - 350 mg/kg

### 生物活性

产品描述	Granisetron HCl 是一种 5-HT3 受体拮抗剂。
靶点	5-HT3
体外研究	Granisetron 阻断猫心室肌细胞的延迟整流电流 (IK), KD 为 4.3 mM。Granisetron 显示了内在的电压依赖性, 该阻断增大去极化。Granisetron 阻断细胞内侧的结合位点, 10%位于跨越跨膜电场。在分离的猫心室肌细胞中, Granisetron (3 mM) 在 0.5 赫兹时延长动作电位时程 (APD) 约 30%。Granisetron 而不是 Ondansetron, 可以防止假 5-HT 的活化; 自身受体, 从而导致 enterochromaffin 细胞中血清素释放的降低。
体内研究	在仔猪中, Granisetron 提供了 cisplatin 引起的呕吐实质性益处, 一些动物在急性和延迟期得到完全保护。在猫中, Granisetron (1mg/kg, 肌肉注射) 每天三次施用显著降低了 cisplatin 诱导干呕+呕吐, 第 1 天和第 2 天分别为 100.0%和 75.0%。在大鼠中, Granisetron 或 dexamethasone 显著改善宏观和组织学分数, 髓过氧化物酶活性, 并降低炎性细胞因子和丙二醛的结肠水平。Granisetron 不仅可以防止 cholera 毒素引起空肠液分泌, 而且成比例地抑制 5-HT 释放到小鼠肠腔。

**用途及描述：**科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。本品是一种高选择性的5-羟色胺 3(5-HT3)受体拮抗剂，对因放疗、化疗及手术引起的恶心和呕吐具有良好的预防和治疗作用。放疗化疗及外科手术等因素可引起肠嗜铬细胞释放 5-HT，5-HT 可激活中枢或迷走神经末梢的 5-HT3 受体而引起呕吐反射。本品控制恶心和呕吐的机制，是通过拮抗中枢化学感受区及外周迷走神经末梢的 5-HT3 受体，抑制恶心、呕吐的发生。本品选择性高，无锥体外系反应、过度镇静等不良反应。

**使用方法推荐：**

**储液配置**

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.8664 mL	14.3320 mL	28.6640 mL
5 mM		0.5733 mL	2.8664 mL	5.7328 mL
10 mM		0.2866 mL	1.4332 mL	2.8664 mL
50 mM		0.0573 mL	0.2866 mL	0.5733 mL

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

### 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

### 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。