

## Topiramate ; 托吡酯

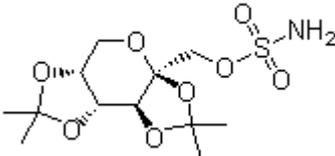
产品编号：MB1640

质量标准：>99%,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	C12H21NO8S	结构式	
分子量	339.36		
CAS No.	97240-79-4		
储存条件	2-8℃，避光防潮密闭干燥。		
溶解性 (25℃)	DMSO 68 mg/mL (200.37 mM) Ethanol 68 mg/mL (200.37 mM) Water Insoluble		
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。		

**简介：**托吡酯 Topiramate 是镇痙化合物，能拮抗 GluR5 受体，还可作为 GABA 受体介导的电流阳性变构调节剂。

**别名：**2,3:4,5-Bis-O-(1-methylethylidene)-36-D-fructo-pyranose sulfamate, McN 4853, RWJ 17021, Topamax

### 物理性状及指标：

外观：.....白色或类白色粉末 White or off-white powder

熔点：.....122-125 °C

溶解性：.....DMSO 68 mg/mL (200.37 mM);Ethanol 68 mg/mL (200.37 mM);Water Insoluble

密度：.....~1.3 g/cm<sup>3</sup> (预测)

含量：.....>99%

IC50：.....CA II: IC50 = 5 nM (人); CA IV: IC50 = 54 nM (人); CA I: IC50 = 250 nM (人);

.....GluR5 红藻氨酸受体：IC50 = 0.46 μM; 碳酸酐酶 II: IC50 = 1.4 μM (大鼠)

.....半数致死剂量 (LD50) 腹膜内的 - 大鼠 - > 1,500 mg/kg

**储存条件：**2-8℃，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Topiramate 是一种多靶点的抑制剂，抑制了 sodium channel 和 calcium channel, AMPA/kainate receptor 以及 carbonic anhydrase 的活性，用于治疗癫痫。			
<b>靶点</b>	sodium channel	Calcium Channel	AMPA/kainate receptor	Carbonic anhydrase
<b>体外研究</b>	Topiramate 轻微抑制分离神经元中 Na <sup>+</sup> 电流的持续组分，并减少 Ca <sup>+</sup> 和 K <sup>+</sup> 流阻断后，在 V 层锥体神经元中被诱发的 Na <sup>+</sup> 依赖性持久动作电位峰。在大鼠杏仁基底外侧核主神经元的全细胞电压钳记录中，Topiramate 在低浓度(IC50，大约为 0.5 mM)下选择性抑制药理学上离体的包含 GluR5 亚基的红藻氨酸受体介导的兴奋性突触电流。Topiramate 也显著地部分抑制 AMPA 受体介导的 EPSCs，但是效力较低。Topiramate (TPM)抑制电敏性 Na <sup>+</sup> 通道和非			

	-N-甲基-D-天冬氨酸(NMDA)受体,并增强 $\gamma$ -氨基丁酸(GABA)介导的抑制。Topiramate 选择性抑制 GluR5 红藻氨酸受体介导的突触后响应。
体内研究	Topiramate (25-100 mg/kg, i.p.)剂量依赖性提高 ATPA 输注诱导的阵挛发作的阈值, ATPA 是一种 GluR5 红藻氨酸受体的选择性激动剂。Topiramate 剂量相关性有效抑制围产期缺氧诱发的急性癫痫发作,计算的 ED50 为 2.1 mg/kg, i.p. Topiramate (20 和 40 mg/kg i.p.)以剂量依赖的方式抑制癫痫强直发作和癫痫小发作,而 Phenytoin (20 mg/kg i.p.)和 Zonisamide (40 mg/kg i.p.)仅抑制强直发作。在 DBA/2 小鼠体内, Topiramate 抑制声音诱导的癫痫发作(ED50 = 8.6 mg/kg p.o.)。

#### 美仑相关产品推荐

MB1640-S	托吡酯 (标准品)
MB25349	托吡酯-d12

**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。托吡酯是一个由氨基酸酯取代单糖的新型抗癫痫药物。在对体外培养的神经细胞元进行电生理和生化研究中发现托吡酯的抗癫痫作用有三个机制: 1.托吡酯可阻断神经元持续去极化导致的反复电位发放, 此作用与使用托吡酯后的时间密切相关, 表明托吡酯可以阻断钠通道; 2.托吡酯可以增加  $\gamma$ -氨基丁酸 (GABA) 激活 GABAA 受体的频率, 加强氯离子内流, 表明托吡酯可增强抑制性中枢神经递质的作用; 3.托吡酯可降低谷氨酸 AMPA 受体的活性, 表明托吡酯可降低兴奋性中枢神经递质的作用。托吡酯可拮抗红藻氨酸(Kainate)激活兴奋性氨基酸(谷氨酸) Kainate/AMPA ( $\alpha$ -氨基-3-羟基-5-甲基异噁唑-4-丙酸) 亚型的作用, 但对 N-甲基-D-天冬氨酸(NMDA)的 NMDA 受体亚型无明显影响。托吡酯的上述作用在 1 $\mu$ M 至 200 $\mu$ M 范围内与浓度相关, 1 $\mu$ M 至 10 $\mu$ M 为产生最小作用的浓度范围。此外, 托吡酯可抑制一些碳酸酐酶同工酶的作周。这一药理作用比已知的碳酸酐酶抑制剂乙酰唑胺作用弱, 并且不是托吡酯抗癫痫作用的主要机制。

#### 储液配置

体 积 \ 浓 度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.9467 mL	14.7336 mL	29.4672 mL
5 mM	0.5893 mL	2.9467 mL	5.8934 mL
10 mM	0.2947 mL	1.4734 mL	2.9467 mL
50 mM	0.0589 mL	0.2947 mL	0.5893 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。