

## 盐酸毛果芸香碱；匹鲁卡品盐酸盐；(+)-Pilocarpine hydrochloride

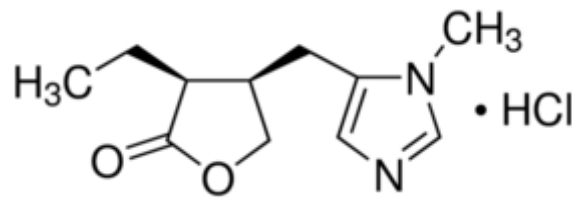
产品编号：MB5259

质量标准：>98%，进分

包装规格：100MG；1G

产品形式：白色粉末

### 基本信息

|              |   |             |  |
|--------------|---|-------------|--|
| 分子式          | C <sub>11</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> · HCl                       | 结<br>构<br>式 |  |
| 分子量          | 244.72  |             |  |
| CAS No.      | 54-71-7   |             |  |
| 储存条件         | -20℃，避光防潮密闭干燥   |             |  |
| 溶解性<br>(25℃) | DMSO 48 mg/mL (196.14 mM)；<br>Water 48 mg/mL (196.14 mM)；<br>Ethanol 48 mg/mL (196.14 mM) |             |  |
| 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：**匹鲁卡品盐酸盐 Pilocarpine Hydrochloride 是一种选择性的 M<sub>3</sub> 型毒蕈碱乙酰胆碱受体 (M<sub>3</sub> muscarinic receptor) 激动剂。

**别名：**(3*S*,4*R*)-4,5-Dihydro-3-ethyl-4-(1-methyl-1*H*-imidazol-5-ylmethyl)-2(3*H*)-furanone hydrochloride

### 物理性状及指标：

外观：.....白色粉末

熔点：.....202-205 °C(lit.)

溶解性：.....DMSO 48 mg/mL (196.14 mM)；Water 48 mg/mL (196.14 mM)；Ethanol 48 mg/mL (196.14 mM)

纯度：.....>98%，进分

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

### 生物活性及研究进展

癫痫模型在癫痫的病理生理研究和抗癫痫药物的研究中发挥着重要的作用。癫痫模型可分为体外模型和整体模型。前者包括神经元模型和脑片模型,主要用于抗癫痫药物的筛选,还能有效的探讨抗癫痫药物的量效关系。而后者通常包括急性癫痫模型、慢性癫痫模型、遗传性癫痫模型和抵抗性癫痫模型。而这些整体模型又各自代表着不同的人类癫痫发作类型。**注射氯化锂---匹罗卡品致大鼠癫痫模型** 近年来一直被认为是研究颞叶癫痫的理想模型。利用药物制备癫痫模型(药物建模)注射药物,通过破坏脑部神经递质释放的平衡,阻断兴奋性氨基酸的循环通路,诱发癫痫发生。

**作用机制：**主要是通过激动乙酰胆碱受体来实现，匹罗卡品注射后，激发了脑内乙酰胆碱能受体，对胆碱能 M 受体的刺激可引起持续性的全身强直-阵挛发作。胆碱能 M 受体同 G 蛋白耦联，G 蛋白将受体的刺激信号传递给磷脂酶 C，磷脂酶 C 水解膜磷脂 4,5 二磷酸-磷脂酰肌醇，使其分解为两种第二信使三磷酸肌醇 (IP<sub>3</sub>) 和二酰甘油 (DG),这两种物质可刺激神经元。亦有研究提示，匹罗卡品亦激活了 NMDA 受体、代谢性谷氨

酸受体，导致了脑内兴奋性系统激活，出现癫痫发作。

|             |   |
|-------------|---|
| <b>产品描述</b> | Pilocarpine HCl 是非选择性毒蕈碱型乙酰胆碱受体激动剂，用于产生癫痫的实验模型。   |
| <b>靶点</b>   | mAChR   |
| <b>体外研究</b> | Pilocarpine 是一种拟副交感神经生物碱，从美国热带灌木的毛果芸香碱类植物的叶子中获得。它是副交感神经系统中非选择性毒蕈碱型受体激动剂，其局部施用能够有效作用于毒蕈碱型乙酰胆碱受体 M3，例如青光眼和口干燥症的治疗。毛果芸香碱作用于虹膜括约肌中毒蕈碱受体 (M3) 的一个亚型，引起肌肉收缩，瞳孔缩小。Pilocarpine 也作用于睫状肌并使其收缩。当睫状肌收缩时，它通过增加巩膜突的张力打开小梁网。这个动作促进眼睛房水比率以降低眼内压。在眼科，毛果芸香碱也可用于减少经历了人工晶状体移植的患者夜晚对灯光产生眩光的可能性，pilocarpine 会产生缩瞳作用，从而减轻这些症状。该用途最常用的浓度为 1% pilocarpine，最低的浓度。Pilocarpine 还能用于治疗比如头颈癌化疗引起的口干干燥症。Pilocarpine 会刺激大量唾液和汗液的分泌。 |

#### 美仑相关产品推荐

|          |                     |                        |
|----------|---------------------|------------------------|
| MB6609   | 戊四唑(PTZ)            | pentylentetrazol,(PTZ) |
| MB2597   | 氯化锂                 | Lithium chloride       |
| MB8257   | 苯妥英 (标准品)           | 5,5-Diphenylhydantoin  |
| MB1296   | Carbamazepine       | 卡马西平                   |
| MB1296-S | Carbamazepine (标准品) | 卡马西平                   |
| MB1627   | 丙戊酸钠                | Sodium valproate       |
| MB1627-S | 丙戊酸钠 (标准品)          | Sodium valproate       |

**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。Pilocarpine HCl 是非选择性毒蕈碱型乙酰胆碱受体激动剂，用于产生癫痫的实验模型。

#### 储液配置

| 浓度    | DMSO 质量   |            |            |
|-------|-----------|------------|------------|
|       | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
| 1 mM  | 4.0863 mL | 20.4315 mL | 40.8630 mL |
| 5 mM  | 0.8173 mL | 4.0863 mL  | 8.1726 mL  |
| 10 mM | 0.4086 mL | 2.0432 mL  | 4.0863 mL  |
| 50 mM | 0.0817 mL | 0.4086 mL  | 0.8173 mL  |

#### 经典实验操作 (仅供参考)

##### 匹罗卡品颞叶癫痫大鼠模型

**方法：**SD 大鼠匹罗卡品腹腔注射，诱发急性癫痫持续状态 (SE) 后，观察慢性期自发性发作；描记 EEG；Neo Timm 染色观察海马苔藓发芽，Nissl 染色观察海马神经元损伤。**结果：**注射匹罗卡品后，87% 的动物呈现 SE，持续 6~24h 后这一部分大鼠均出现慢性自发性发作，组织学检查发现海马有显著的神经元损伤，齿状回内分子层苔藓纤维发芽。**结论：**匹罗卡品模型基本复制了人类颞叶癫痫的临床病理特征；SE 所致的海马结构

性损伤及苔藓纤维重构是自发性发作形成的基础

### 氯化锂-匹罗卡品致大鼠急性癫痫模型

方法：Wistar 大鼠 55 只，随机分为生理盐水对照组、地西洋组和致痫组。氯化锂腹腔注射后 10~10h 后给予匹罗卡品。结果生理盐水对照组大鼠均为 0 级发作，地西洋组中 8 只大鼠为 0 级发作，2 只出现 I 级发作；致痫组均达到Ⅲ级以上的病性发作，其中Ⅲ级 2 只(2/35)，IV级 3 只(3/35)，V级 30 只(30/35)。致痫组大鼠在匹罗卡品腹注射后 10~90min 内全部出现急性病性发作。结论氯化锂-匹罗卡品诱导的大鼠急性癫痫模型具有制作方便、致病成功率高和动物死亡率低等特点，具有同人类癫痫持续状态和颞叶癫痫相似的行为和脑电图改变。

|             |  |
|-------------|--|
| <b>细胞实验</b> | 细胞活力通过 MTT 测定来确定。简而言之，将 HCS 细胞以 $1 \times 10^4$ 个细胞/100 $\mu$ L/孔的密度接种到 96 孔培养板 (Nunc) 中，并培养和处理。间隔 4 小时，用 100 $\mu$ L 含 1.0 g/L MTT 的无血清 DMEM / F12 培养基代替含毛果芸香碱 (0.625 至 20 g/L) 的培养基，并将细胞在 37°C 4 小时。在谨慎丢弃含有 MTT 的培养基后，加入 150 $\mu$ L DMSO 以在 37°C 下在黑暗中溶解产生的甲 crystals 晶体 15 分钟，并用酶标仪测量 490nm 处的吸光度。 |
| <b>动物实验</b> | 大鼠<br>雄性，10 周龄的 Wistar 大鼠被分配到两组中的一组，锻炼 (EX, n = 6) 和对照 (CN, n = 6)。将 EX 大鼠在运行轮 (SN-451) 的笼中保持 40 天，使其能够进行自主运动，而将 CN 大鼠保持在笼中，并且锁定运行轮。在第 40 天，如下测量毛果芸香碱诱导的唾液。简而言之，将大鼠麻醉，将预先称重的棉花舌下置于其口中，并且经皮腹膜内注射毛果芸香碱 (0.5mg/kg) 以诱导唾液分泌。然后每 10 分钟更换一次棉球 1 小时。再次称量收集的棉球，通过从最终重量中减去初始值来计算分泌唾液的质量。                        |

#### 【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。