



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

产品名称: **Tiagabine Hydrochloride**
CAS 号: **145821-59-6**
产品货号: **S83415**

生物活性:				
Description	Tiagabine hydrochloride 是一种抗惊厥剂, 也是 GAT-1 GABA 转运体的选择性抑制剂, 其 K_i 值为 $\sim 0.1 \mu M$ 。Tiagabine hydrochloride 对突触体、神经元和神经胶质中 $[3H]GABA$ 的再摄取具有强效的选择性抑制作用, IC_{50} 分别为 67、446 和 182 nM。Tiagabine hydrochloride 具有神经保护特性 [1][2][3][4][5][6][7]。			
IC50 & Target[8]	TrkB			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	CHO	IC_{50}	0.049 μM	Inhibition of human GAT1 transfected in CHO cells assessed as $[3H]GABA$ uptake after 20 mins by liquid scintillation counting analysis
In Vitro	Tiagabine ($0.1 \mu M$) hydrochloride 可抑制猪脑颞叶皮层和白质对 GABA 的摄取 (分别为 50% 和 60-68%)[2]。 Tiagabine ($0.1-5 \mu M$) hydrochloride 可保护 PC12 细胞中的神经元免受突变型 huntingtin (htt) 诱导的毒性影响[4]。 Tiagabine ($20-100 \mu M$, 1 h) hydrochloride 可提高经 1 mM MPP+ 处理的 SH-SY5Y 细胞的存活率[5]。 Tiagabine (25 min) hydrochloride 抑制 HEK293 细胞中表达的小鼠 GAT1 对 $[3H]GABA$ 的摄取, IC_{50} 为 $0.07 \mu M$[6]。			
In Vivo	Tiagabine hydrochloride ($2-5 mg/kg$, 腹腔注射, 每天一次) 对 N171-82Q 和 R6/2 亨廷顿氏病小鼠模型具有神经保护作用, 可改善运动能力, 减轻脑萎缩和神经变性[4]。			
	Tiagabine hydrochloride ($5 mg/kg$, 腹腔注射) 在 MPTP 和 LPS 诱导的帕金森病小鼠模型中起到抑制神经纹状体小胶质细胞活化的作用, 并减少多巴胺能神经元的损失[5]。			
	Tiagabine hydrochloride 在大鼠神经病理性疼痛模型 ($3-30 mg/kg$, 腹腔注射) 中显示出剂量依赖性抗痛觉作用, 在小鼠急性热痛中显示出抗痛作用 (热板试验, $3-10 mg/kg$, 腹腔注射)[7]。			
	Tiagabine ($0.5-2 mg/kg$, 腹腔注射, 21 天) hydrochloride 可抑制 Pentylentetrazole 诱导的小鼠癫痫发作, 并通过调节 BDNF/TrkB 表达和神经炎症标志物改善行为和认知参数[8]。			
	Animal Model:	Tight ligation of L5 and L6 spinal nerves innervating the left hindpaw was performed using aseptic techniques in rats[7]		
	Dosage:	$7.2, 24.3, \text{ and } 72.8 \mu mol/kg$ (3, 10, and 30 mg/kg)		
	Administration:	Intraperitoneal injection (i.p.)		
	Result:	Increased response threshold to tactile stimulation at the highest dose of tiagabine ($72.8 \mu mol/kg$) at both 15 and 30 min after injection.		
	Animal Model:	Male mice[7]		
	Dosage:	$0.2, 0.7, 2.4, 7.2, \text{ and } 24.3 \mu mol/kg$ (0.1, 0.3, 1, 3, 10 mg/kg)		
	Administration:	Intraperitoneal injection (i.p.)		
	Result:	Significantly increased foot-licking latency in the hot-plate test at 7.2 and $24.3 \mu mol/kg$. Significantly increased jump latency at $24.3 \mu moles/kg$.		



Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (303.39 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)

H₂O 中的溶解度 : 100 mg/mL (242.71 mM); 超声助溶)

Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.4271 mL	12.1356 mL	24.2713 mL
	5 mM	0.4854 mL	2.4271 mL	4.8543 mL
	10 mM	0.2427 mL	1.2136 mL	2.4271 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 (sealed storage, away from moisture)。-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。

* 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。

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: ≥ 2.08 mg/mL (5.05 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (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; 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.05 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (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。

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: ≥ 2.08 mg/mL (5.05 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Braestrup C, et al. (R)-N-[4,4-bis(3-methyl-2-thienyl)but-3-en-1-yl]nipecotic acid binds with high affinity to the brain gamma-aminobutyric acid uptake carrier. J Neurochem. 1990 Feb;54(2):639-47. [2]. Henjum S, Hassel B. High-affinity GABA uptake and GABA-metabolizing enzymes in pig forebrain white matter: a quantitative study. Neurochem Int. 2007 Jan;50(2):365-70. [3]. Sheehan DV, Sheehan KH, Raj BA, Janavs J. An open-label study of tiagabine in panic disorder. Psychopharmacol Bull. 2007;40(3):32-40. [4]. Masuda N, Peng Q, Li Q, Jiang M, Liang Y, Wang X, Zhao M, Wang W, Ross CA, Duan W. Tiagabine is neuroprotective in the N171-82Q and R6/2 mouse models of Huntington's disease. Neurobiol Dis. 2008 Jun;30(3):293-302. [5]. Liu J, Huang D, Xu J, Tong J, Wang Z, Huang L, Yang Y, Bai X, Wang P, Suo H, Ma Y, Yu M, Fei J, Huang F. Tiagabine Protects Dopaminergic Neurons against Neurotoxins by Inhibiting Microglial Activation. Sci Rep. 2015 Oct 26;5:15720. [6]. Sindelar M, Lutz TA, Petrera M, Wanner KT. Focused pseudostatic hydrazone libraries screened by mass spectrometry binding assay: optimizing affinities toward γ-aminobutyric acid transporter 1. J Med Chem. 2013 Feb 14;56(3):1323-40. [7]. Giardina W J, Decker M W, Porsolt R D, et al. An evaluation of the GABA uptake blocker tiagabine in animal models of neuropathic and nociceptive pain. Drug development research, 1998, 44(2-3): 106-113. [8]. Javaid S, Alqahtani F, Ashraf W, Anjum SMM, Rasool MF, Ahmad T, Alasmari F, Alasmari AF, Alqarni SA, Imran I. Tiagabine suppresses pentylenetetrazole-induced seizures in mice and improves behavioral and cognitive parameters by modulating BDNF/TrkB expression and neuroinflammatory markers. Biomed Pharmacother. 2023 Apr;160:114406.
------	---

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 (sealed storage, away from moisture)。-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	2.4271 mL	12.1356 mL	24.2713 mL	60.6781 mL
	5 mM	0.4854 mL	2.4271 mL	4.8543 mL	12.1356 mL
	10 mM	0.2427 mL	1.2136 mL	2.4271 mL	6.0678 mL
	15 mM	0.1618 mL	0.8090 mL	1.6181 mL	4.0452 mL
	20 mM	0.1214 mL	0.6068 mL	1.2136 mL	3.0339 mL
	25 mM	0.0971 mL	0.4854 mL	0.9709 mL	2.4271 mL
	30 mM	0.0809 mL	0.4045 mL	0.8090 mL	2.0226 mL
	40 mM	0.0607 mL	0.3034 mL	0.6068 mL	1.5170 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: shyysw@sina.com

	50 mM	0.0485 mL	0.2427 mL	0.4854 mL	1.2136 mL
	60 mM	0.0405 mL	0.2023 mL	0.4045 mL	1.0113 mL
	80 mM	0.0303 mL	0.1517 mL	0.3034 mL	0.7585 mL
	100 mM	0.0243 mL	0.1214 mL	0.2427 mL	0.6068 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶