

Prucalopride ; 普卡必利

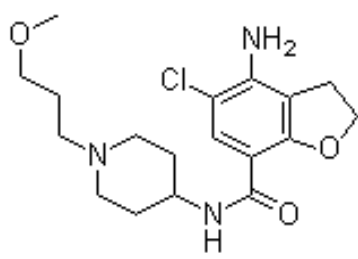
产品编号：MB3670

质量标准：>98%，5-HT 受体激动剂

包装规格：20MG;100MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C18H26ClN3O3	结 构 式	
分子量	367.87		
CAS No.	179474-81-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 60 mg/mL (163.1 mM) Water : Insoluble Ethanol : 38 mg/mL (103.29 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：普卢卡必利 Prucalopride (R093877)是高亲和性 5-HT₄ 受体激动剂，对 5-HT_{4a}/4b 的 pK_i 分别为 8.6/8.1，比对其它受体的亲和性高 150 倍。

别名：

4-Amino-5-chloro-2,3-dihydro-*N*-[1-(3-methoxypropyl)-4-piperidinyl]-7-benzofurancarboxamide

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 60 mg/mL (163.1 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 38 mg/mL (103.29 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Prucalopride 是一种选择性，高亲和力的 5-HT 受体激动剂，作用于 5-HT _{4A} 和 5-HT _{4B} 受体，K _i 分别为 2.5 nM 和 8 nM，比作用于 5-HT 受体亚型选择性高 290 倍以上。	
靶点	5-HT _{4a}	5-HT _{4b}
	2.5 nM (K _i)	8 nM (K _i)
体外研究	Prucalopride 以浓度依赖的方式诱导收缩，pEC ₅₀ 为 7.5。Prucalopride (1 mM)显著放大电刺激后豚鼠近端结肠的反弹收缩。Prucalopride 诱导大鼠食道粘膜肌层放松，pEC ₅₀ 为 7.8，产生单相浓度响应曲线。	
体内研究	Prucalopride 给药 2 mg 和 4 mg，每周完整的排便分别为 30.9%和 28.4%，而安慰剂对照组为 12.0%。47.3%接受 2 mg Prucalopride 的患者和 46.6%接受 4 mg Prucalopride 的患者会增加自发性的次数，平均每周完整的排便为一次或更多，而安慰剂对照组为 25.8%。Prucalopride (2 mg 或 4 mg)显著提高所有其它次要疗效终点，包括患者对他们肠功能和治疗的满意度，以及对他们便秘症状严重度的感觉。Prucalopride (4 mg 每天)加速便秘患者	

整体的胃排空和小肠转运，而不会造成肠道排空障碍。Prucalopride (4 mg 每天)趋于加速整体的结肠运输，使整体结肠运输显著更快，并且提高结肠的排空速度。Prucalopride 2 mg (19.5%) , 4 mg (23.6%)给药，更高比例的患者具有三次或更多次的自发性完整排便(SCBM)/周，而安慰剂对照组为 9.6%。Prucalopride 也会显著提高刺激效能和生活终点的质量。在禁食的狗体内，Prucalopride 通过刺激邻近结肠中高振幅群收缩，并抑制远端结肠的收缩活性，剂量依赖性改变结肠收缩运动模式。Prucalopride 也会引起首次大幅迁移收缩(GMC)的时间剂量依赖性减少；在更高剂量 prucalopride 下，首次 GMC 通常发生在治疗后半个小时内。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3737	WAY-100635 Maleate
MB3795	VUF 10166

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。普卡洛必利是一种具有肠动学活性的选择性5-HT₄ 5-羟色胺受体激动剂。5-HT₄受体是在中枢神经系统和周围组织中表达的GPCRs。这种受体在肠易激综合症和特发性便秘等胃肠道运动障碍中发挥作用。激动剂是促动力的，对运动性减弱的逆变器有潜在的用途。普卡洛必利是一种具有肠动学活性的选择性 5-HT₄ 5-羟色胺受体激动剂。Prucalopride 的 pK(i)值分别为人类 5-HT(4a)受体和 5-HT(4b)受体分别为 8.60 和 8.10,5-HT₄ 选择性至少是其他 5-羟色胺和多巴胺受体的 290 倍。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.7184 mL	13.5918 mL	27.1835 mL
5 mM		0.5437 mL	2.7184 mL	5.4367 mL
10 mM		0.2718 mL	1.3592 mL	2.7184 mL
50 mM		0.0544 mL	0.2718 mL	0.5437 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。