



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: Mosapride
CAS 号: 112885-41-3
产品货号: S80109

生物活性:

Description	Mosapride 是一种具有口服活性的促胃肠动力化合物, 是一种 5HT4 激动剂。Mosapride 是一种 CYP 诱导剂。Mosapride 对 Kv4.3 具有浓度依赖的抑制作用, 其 IC50 值为 15.2 μM。Mosapride 可用于胃肠疾病的研究。				
IC50 & Target	5-HT4 Receptor				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	IC50	4.8 μM	Inhibition of human ERG expressed in HEK293 cells by whole cell patch clamp method	
In Vitro	Mosapride (1-100 nM) 显著增加了豚鼠结肠近端和远端收缩的平均幅度, 缩短了结肠近端和远端转运时间[3]。 Mosapride (869 ng/mL, 48 h) 在人肝细胞 (HMC424, 478 和 493) 中增加 Cytochrome P450 (CYP1A2、2B6 和 3A4) 的诱导能力[4]。				
In Vivo	Mosapride citrate (0.3-3 mg/kg 或 30 mg/kg 口服) 促进大鼠胃排空, 呈剂量依赖性。剂量为 30 mg/kg 时显著抑制大鼠胃排空[5]。 Mosapride citrate (0.25, 0.5, 0.75 mg/kg 口服) 在大鼠中可通过激活 5-HT4 受体来减轻非甾体抗炎药诱导的溃疡[6]。				
	Animal Model:		NSAID-induced experimental ulcer model		
	Dosage:		0.25, 0.5 , 0.75 mg/kg		
	Administration:		p.o		
	Result:		Inhibited the mucosal damage.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 66.67 mg/mL (158.03 mM); 超声助溶 (<60°C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration	Mass 1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.3703 mL	11.8514 mL	23.7029 mL
		5 mM	0.4741 mL	2.3703 mL	4.7406 mL
		10 mM	0.2370 mL	1.1851 mL	2.3703 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。-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。 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				



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: shyyysw@sina.com

	方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: $\geq 5 \text{ mg/mL}$ (11.85 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 5 \text{ mg/mL}$ (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 50.0 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]. Tack J, et al. Systematic review: cardiovascular safety profile of 5-HT(4) agonists developed for gastrointestinal disorders. Aliment Pharmacol Ther. 2012 Apr;35(7):745-67. [2]. Curran MP, et al. Mosapride in gastrointestinal disorders. Drugs. 2008;68(7):981-91. [3]. Kim HS, et al. The effect of mosapride citrate on proximal and distal colonic motor function in the guinea-pig in vitro. Neurogastroenterol Motil. 2008 Feb;20(2):169-76. [4]. Kim YH, et al. Measurement of Human Cytochrome P450 Enzyme Induction Based on Mesalazine and Mosapride Citrate Treatments Using a Luminescent Assay. Biomol Ther (Seoul). 2015 Sep;23(5):486-92. [5]. Uchida M, et al. Dual role of mosapride citrate hydrate on the gastric emptying evaluated by the breath test in conscious rats. J Pharmacol Sci. 2013;121(4):282-7. [6]. Fujisawa M, et al. The 5-HT4 receptor agonist mosapride attenuates NSAID-induced gastric mucosal damage. J Gastroenterol. 2010 Feb;45(2):179-86. [7]. Sung KW, et al. Effect of mosapride on Kv4.3 potassium channels expressed in CHO cells. Naunyn Schmiedebergs Arch Pharmacol. 2013 Oct;386(10):905-16

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。 -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	2.3703 mL	11.8514 mL	23.7029 mL	59.2572 mL
	5 mM	0.4741 mL	2.3703 mL	4.7406 mL	11.8514 mL
	10 mM	0.2370 mL	1.1851 mL	2.3703 mL	5.9257 mL
	15 mM	0.1580 mL	0.7901 mL	1.5802 mL	3.9505 mL
	20 mM	0.1185 mL	0.5926 mL	1.1851 mL	2.9629 mL
	25 mM	0.0948 mL	0.4741 mL	0.9481 mL	2.3703 mL
	30 mM	0.0790 mL	0.3950 mL	0.7901 mL	1.9752 mL
	40 mM	0.0593 mL	0.2963 mL	0.5926 mL	1.4814 mL
	50 mM	0.0474 mL	0.2370 mL	0.4741 mL	1.1851 mL
	60 mM	0.0395 mL	0.1975 mL	0.3950 mL	0.9876 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

	80 mM	0.0296 mL	0.1481 mL	0.2963 mL	0.7407 mL
	100 mM	0.0237 mL	0.1185 mL	0.2370 mL	0.5926 mL



源叶