

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	Y10001
产品名称:	Y-27632 dihydrochloride

产品简介:

一种 ROCK-1、ROCK-2 抑制剂。

Y-27632 dihydrochloride is a selective Rho-kinase inhibitor, which suppresses cholinergic nerve-mediated contractions. In addition, studies show that Y-27632 dihydrochloride increases the release of neurotransmitters from cholinergic nerves. Studies conducted on smooth muscle preparations suggest that Y-27632 dihydrochloride suppresses nerve-mediated contractile responses stimulated by acetylcholine and noradrenaline. Furthermore, studies on lung tissue damage in rats suggest that Y-27632 dihydrochloride can restore the damage caused by oleic acid by inhibition of ROCK-1 and ROCK-2. Y-27632 dihydrochloride also inhibits protein kinase C related kinase, PRK2.

靶点:	ROCK-I	ROCK-II	PKN	Citron kinase	PKC α	PKA
	220 nM (Ki)	300 nM (Ki)	3.1 μ M (Ki)	5.3 μ M (Ki)	73 μ M (Ki)	25 μ M (Ki)

体外研究:

Y-27632 dihydrochloride (1-5 μ M; 0-60 分钟) 促进脂肪组织来源的干细胞 (ADSCs) 的神经元分化。

Y-27632 dihydrochloride (1-5 μ M; 0-60 分钟) 诱导 ADSCs 中 NSE、MAP-2 和巢蛋白的表达。

体内研究:

Y-27632 dihydrochloride (口服灌胃; 30 mg/kg; 每日一次; 4 周) 预防二甲基亚硝胺诱导的大鼠肝纤维化。

Y-27632 dihydrochloride (口服灌胃; 5- 10 mg/kg; once) 对 PTZ 和 MES 诱发的癫痫有抗癫痫作用。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验				
溶于水 (14mg/ml)、乙醇 (~5mg/ml)、DMSO (~20mg/ml)、DMF (~30mg/ml)、PBS (pH 7.2 ~10mg/ml) 和甲醇 (25mg/ml)。				
浓度 \ 溶液体积	质量			
	1mg	5mg	10mg	
	1 mM	3.1225 mL	15.6123 mL	31.2246 mL
	5 mM	0.6245 mL	3.1225 mL	6.2449 mL
10 mM	0.3122 mL	1.5612 mL	3.1225 mL	
储备液的保存方式: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。				
二: 体内实验				
1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline				
Solubility: \geq 2.5 mg/mL (7.81 mM); 澄清溶液				
此方案可获得 \geq 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。				
以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。				



2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% (20% SBE-β-CD in Saline)

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.81 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 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。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.81 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

4、请依序添加每种溶剂： 5% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→50% Saline

Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (3.90 mM); 澄清溶液

5、请依序添加每种溶剂： 5% DMSO→95% (20% SBE-β-CD in Saline)

Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (3.90 mM); 澄清溶液

6、请依序添加每种溶剂： PBS

Solubility: 220 mg/mL (686.94 mM); 澄清溶液; 超声助溶

注：工作液建议您现用现配, 当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。

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。

三、激酶实验

磷酸化反应:

在 COS 细胞中表达的 p160ROCK 作为标记的全长蛋白, 使用抗标签抗体进行免疫沉淀反应。在不同浓度 Y-27632 存在时, p160ROCK (30 ng) 和 40 μ M [γ 32P]ATP(3.3 Ci/mmol) 及 3 μ g 组蛋白(HF2A), 去磷酸化的酪蛋白或 MBP 在 30°C 下温育, 总体积为 31 μ L。分别在 0, 5, 10, 和 20 分钟采集 7 μ L 等分样, 与等体积 2 \times Laemmli 样本缓冲液混合, 然后进行 SDS-PAGE。使用考马斯亮蓝对凝胶进行染色, 烘干, 然后通过 Bioimage Analyzer BAS2000 分析。获得抑制 50%p160ROCK 活性所需的 Y-27632 浓度(IC50 值)。

四、动物实验

动物模型: 携带自发或诱发高血压的雄性 Wistar 大鼠; 艾利希腹水癌小鼠模型

剂量: 30 mg/kg/day (大鼠); 0-10 mg/kg (小鼠)

给药处理: 口服处理 (大鼠); ip (小鼠)

注意事项:

1、为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: -20°C

