

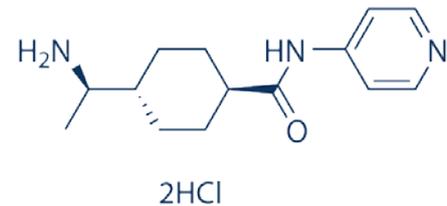
Y-27632 (ROCK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0326-10mM	Y-27632 (ROCK 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0326-5mg	Y-27632 (ROCK 抑制剂)	5mg
SC0326-25mg	Y-27632 (ROCK 抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[(1R)-1-aminoethyl]-N-pyridin-4-ylcyclohexane-1-carboxamide;dihydrochloride
简称	Y-27632
别名	Y 27632 dihydrochloride; Y27632 dihydrochloride; Y 27632, (4(R)-trans)-isomer; Y 27632, (4(S)-trans)-isomer; Y 27632, (trans)-isomer; Y 27632, dihydrochloride, (4(R)-trans)-isomer; Y 27632; Y27632
中文名	—
化学式	C ₁₄ H ₂₁ N ₃ O·2HCl
分子量	320.26
CAS号	129830-38-2
纯度	≥98%
溶剂/溶解度	Water 14mg/ml; DMSO 64mg/ml warming; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.56ml DMSO, 或者每3.20mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0326-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Y-27632 2HCl是一种选择性ROCK1 (p160ROCK)抑制剂,无细胞试验中Ki为140nM,比对其他激酶包括PKC, cAMP依赖性蛋白激酶, mlCK和PAK的作用强200多倍。				
信号通路	Actin Dynamics				
靶点	ROCK1 (p160ROCK)	ROCK2	—	—	—
IC50	140nM(Ki)	300nM(Ki)	—	—	—
体外研究	Y-27632也同等有效抑制ROCK-II。Y-27632作用于PKC, cAMP依赖的蛋白激酶和肌球蛋白轻链激酶(mlCK)几乎没有活性, Ki分别为26μM,25μM和>250μM。Y-27632通过选择性抑制Ca ²⁺ 敏感化,而抑制多种兴奋剂而不是KCl,包括Phenylephrine, Histamine, Acetylcholine, Serotonin, Endothelin和Thromboxane诱导的平滑肌收缩, IC50为0.3-1μM。Y-27632 作用于培养的细胞,抑制Rho诱导的, p160ROCK调节的应力纤维的形成。Y-27632处理,阻断 Rho调节的肌动球蛋白的激活,也阻断LPA刺激的MM1 细胞入侵活性,这种作用存在浓度依赖性。10μM Y-27632处理在无血清悬浮(SFEB)培养基中的人类胚胎干细胞(hES),显著减少分离诱导的凋亡,提高克隆效率(从~1%提高到~27%),转基因后促进亚克隆,且使SFEB培养的hES细胞存活及分化成Bf1+皮质和基底端脑祖细胞。				
体内研究	Y-27632按30mg/kg剂量口服处理自发性高血压大鼠,肾性高血压大鼠,及去氧皮质酮醋酸(DOCA)盐高血压大鼠,显著降低血压,这种作用存在剂量依赖性。Y-27632按每小时0.55μl通过植入泵持续处理表达Val ¹⁴ -RhoA的大鼠,持续11天,延迟mM1细胞入侵。Y-27632作用于肺循环,通过抑制ROCK,降低缺氧诱导的血管生成和血管重构。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	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(30ng)和40μM [γ - ³² P]ATP(3.3Ci/mmol)及3μg组蛋白(HF2A), 去磷酸化的酪蛋白或 MBP在30°C下温育, 总体积为31μl。分别在0, 5, 10和20分钟采集7μl等分样, 与等体积2×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)。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

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
配制	溶于DMSO, 然后在盐水中稀释(大鼠); 0.9% NaCl(小鼠)
剂量	30mg/kg/day(大鼠); 0-10mg/kg(小鼠)
给药方式	口服处理(大鼠); ip(小鼠)

参考文献:

1. Uehata M, et al. Nature, 1997, 389(6654), 990-994.
2. Itoh K, et al. Nat Med, 1999, 5(2), 221-225.
3. Bito H, et al. Neuron, 2000, 26(2), 431-441.
4. Watanabe K, et al. Nat Biotechnol, 2007, 25(6), 681-686.
5. Hyvelin JM, et al. Circ Res, 2005, 97(2), 185-191.
6. Ishizaki T, et al. Mol Pharmacol. 2000, 57(5), 976-983.
7. Isler D, et al. Pharmacol Rep. 2014, 66(1), 114-120.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0326-10mM	Y-27632 (ROCK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0326-5mg	Y-27632 (ROCK抑制剂)	5mg
SC0326-25mg	Y-27632 (ROCK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月内有效。

注意事项:

- 本产品可能对人体有一定的毒害作用, 请注意适当防护, 以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:
<https://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>