



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: **CCG-203971**
CAS 号: **1443437-74-8**
产品货号: **S88403**

生物活性:						
Description		CCG-203971 是第二代 Rho/MRTF/SRF 通路抑制剂。CCG-203971 有效靶向 RhoA/C 激活的 SRE 荧光素酶 (IC50=6.4 μM)。CCG-203971 抑制 PC-3 细胞迁移, IC50 为 4.2 μM。CCG-203971 具有潜在的抗转移作用。				
IC50 & Target		RhoA/MRTF-A[1]				
Cellular Effect		Cell Line	Type	Value	Description	
		HCT-116	IC50	76.5 μM	Antiproliferative activity against human HCT-116 cells assessed as inhibition of cell growth measured after 72 hrs by CCK-8 method	
		PC-3	IC50	4.2 μM	Antimetastatic activity against human PC3 cells after 24 hrs by scratch wound assay	
		PC-3	IC50	6.4 μM	Inhibition of RhoC-mediated pathway in human PC3 cells assessed as inhibition of SRE-regulated gene transcription by luciferase reporter gene assay	
In Vitro		CCG -203971, 第二代 Ras 同源基因家族, 成员 A (RhoA)/心肌相关转录因子 A (MRTF-A)/血清反应因子 (SRF) 通路抑制剂, 抑制基质硬度和转化生长因子 β - 由蛋白质和基因表达以剂量依赖性方式确定的介导的纤维发生。CCG -203971 在 25 μM 浓度下显著抑制 TGF-β 诱导的 MKL1 表达[2]。将人真皮成纤维细胞接种到 96 孔板上, 并在 30 μM CCG -203971 或 DMSO 载体存在的情况下生长 3 天。通过水溶性四唑染料 WST-1 的酶促还原评估活细胞密度。硬皮病真皮成纤维细胞比正常细胞增殖更快, CCG -203971[3]可抑制这种增殖。				
In Vivo		CCG -203971 在博来霉素皮肤损伤模型中进行了测试。博来霉素溶于 50 μL DMSO 中经腹膜内给药。初步研究表明, 以这种方式给药的博来霉素在 100 mg/kg 每天两次时耐受性良好。与未接受博来霉素的 PBS+DMSO 组相比, 皮内注射博来霉素 2 周以及 DMSO 对照 (50 μL ip) 导致显著的真皮增厚 (P<0.0001)。CCG -203971 处理强烈且显著 (P<0.001) 抑制了该模型中博来霉素诱导的皮肤增厚。通过测量羟脯氨酸含量评估的皮肤胶原蛋白量显示出相似的结果。博来霉素注射剂促进胶原沉积 (P<0.01), CCG -203971 能够阻断这种作用 (P<0.05)[3]。				
Solvent&Solubility		细胞实验:				
		DMSO 中的溶解度 : 200 mg/mL (489.14 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)				
		Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
			1 mM	2.4457 mL	12.2285 mL	24.4571 mL
			5 mM	0.4891 mL	2.4457 mL	4.8914 mL
10 mM	0.2446 mL		1.2229 mL	2.4457 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。						
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。						



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

	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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (6.11 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 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 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.09 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 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.09 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]. Bell JL, et al. Optimization of novel nipecotic bis(amide) inhibitors of the Rho/MKL1/SRF transcriptional pathway as potential anti-metastasis agents. Bioorg Med Chem Lett. 2013 Jul 1;23(13):3826-32. [2]. Johnson LA, et al. Novel Rho/MRTF/SRF inhibitors block matrix-stiffness and TGF-β-induced fibrogenesis in human colonic myofibroblasts. Inflamm Bowel Dis. 2014 Jan;20(1):154-65. [3]. Haak AJ, et al. Targeting the myofibroblast genetic switch: inhibitors of myocardin-related transcription factor/serum response factor-regulated gene transcription prevent fibrosis in a murine model of skin injury. J Pharmacol Exp Ther. 2014 Jun;349(3):480-6.				
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, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时，请在 2 年内使用， -20° C 储存时，请在 1 年内使用。					
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg



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

DMSO	1 mM	2.4457 mL	12.2285 mL	24.4571 mL	61.1426 mL
	5 mM	0.4891 mL	2.4457 mL	4.8914 mL	12.2285 mL
	10 mM	0.2446 mL	1.2229 mL	2.4457 mL	6.1143 mL
	15 mM	0.1630 mL	0.8152 mL	1.6305 mL	4.0762 mL
	20 mM	0.1223 mL	0.6114 mL	1.2229 mL	3.0571 mL
	25 mM	0.0978 mL	0.4891 mL	0.9783 mL	2.4457 mL
	30 mM	0.0815 mL	0.4076 mL	0.8152 mL	2.0381 mL
	40 mM	0.0611 mL	0.3057 mL	0.6114 mL	1.5286 mL
	50 mM	0.0489 mL	0.2446 mL	0.4891 mL	1.2229 mL
	60 mM	0.0408 mL	0.2038 mL	0.4076 mL	1.0190 mL
	80 mM	0.0306 mL	0.1529 mL	0.3057 mL	0.7643 mL
	100 mM	0.0245 mL	0.1223 mL	0.2446 mL	0.6114 mL

源叶