



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: **RKI-1447**
CAS 号: **1342278-01-6**
产品货号: **S89033**

生物活性:

Description	RKI-1447 是高效的 ROCK1 和 ROCK2 的小分子抑制剂, IC50 值分别为 14.5 nM 和 6.2 nM。				
IC50 & Target[1]	ROCK2	ROCK1			
	6.2 nM (IC50)	14.5 nM (IC50)			
In Vitro	RKI-1447 是一种 I 型激酶抑制剂, 通过与铰链区和 DFG 基序的相互作用结合 ATP 结合位点。RKI-1447 抑制人癌细胞中 ROCK 底物 MLC-2 和 MYPT-1 的磷酸化, 但浓度高达 10 μM 时对 AKT、MEK 和 S6 激酶的磷酸化水平没有影响。RKI-1447 在抑制 ROCK 介导的细胞骨架重组方面也具有高度选择性。RKI-1447 抑制乳腺癌细胞的迁移、侵袭和贴壁依赖性肿瘤生长[1]。				
In Vivo	RKI-1447 在抑制转基因小鼠模型中乳腺肿瘤的生长方面非常有效。RKI-1447 抑制了 87% 的乳腺肿瘤生长, 与接受载体对照的小鼠相比, RKI-1447 处理小鼠的乳腺肿瘤平均小 7.7 倍[1]				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 50 mg/mL (153.20 mM); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	* "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.0640 mL	15.3200 mL	30.6401 mL
		5 mM	0.6128 mL	3.0640 mL	6.1280 mL
		10 mM	0.3064 mL	1.5320 mL	3.0640 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。					
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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline					
Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.66 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 μL 25.0 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 二					



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

	请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.66 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 μL 25.0 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]. Patel RA, et al. RKI-1447 is a potent inhibitor of the Rho-associated ROCK kinases with anti-invasive and antitumor activities in breast cancer. Cancer Res. 2012 Oct 1;72(19):5025-34.

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
DMSO	1 mM	3.0640 mL	15.3200 mL	30.6401 mL	76.6002 mL
	5 mM	0.6128 mL	3.0640 mL	6.1280 mL	15.3200 mL
	10 mM	0.3064 mL	1.5320 mL	3.0640 mL	7.6600 mL
	15 mM	0.2043 mL	1.0213 mL	2.0427 mL	5.1067 mL
	20 mM	0.1532 mL	0.7660 mL	1.5320 mL	3.8300 mL
	25 mM	0.1226 mL	0.6128 mL	1.2256 mL	3.0640 mL
	30 mM	0.1021 mL	0.5107 mL	1.0213 mL	2.5533 mL
	40 mM	0.0766 mL	0.3830 mL	0.7660 mL	1.9150 mL
	50 mM	0.0613 mL	0.3064 mL	0.6128 mL	1.5320 mL
	60 mM	0.0511 mL	0.2553 mL	0.5107 mL	1.2767 mL
	80 mM	0.0383 mL	0.1915 mL	0.3830 mL	0.9575 mL
	100 mM	0.0306 mL	0.1532 mL	0.3064 mL	0.7660 mL