



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: **ROCK inhibitor-2**

CAS 号: **1127308-52-4**

产品货号: **S89189**

生物活性:

Description	ROCK inhibitor-2 (compound 6) 是一种选择性 ROCK1 和 ROCK2 双抑制剂, IC50 值分别为 160 nM 和 21 nM。ROCK inhibitor-2 对 pMYPT1 的 IC50 为 75 nM。ROCK inhibitor-2 具有抗肿瘤活性。							
IC50 & Target[1]	<table><tr><td>ROCK1</td><td>ROCK2</td></tr><tr><td>160 nM (IC50)</td><td>21 nM (IC50)</td></tr></table>				ROCK1	ROCK2	160 nM (IC50)	21 nM (IC50)
ROCK1	ROCK2							
160 nM (IC50)	21 nM (IC50)							
In Vitro	ROCK inhibitor-2 (50 μM, 24-48 h) 减少了 U2OS 细胞内的细胞内结构的形成, 抑制了 U2OS 的细胞迁移和侵袭, 并导致线粒体功能障碍[2]。							
	Cell Migration Assay [2]							
	Cell Line:	U2OS						
	Concentration:	50 μM						
	Incubation Time:	48 h						
	Result:	Inhibited cell migration.						
	Western Blot Analysis[2]							
	Cell Line:	U2OS						
	Concentration:	50 μM						
	Incubation Time:	24 h						
Result:	Downregulated the expression of PGC1 伪, NRF1 and TFAM.							
In Vivo	ROCK inhibitor-2 (10 mg/kg*day, ip, 27 days) 在小鼠异种移植模型中表现出抗肿瘤活性[2]。							
	Animal Model:	U2OS xenograft mouse models[2]						
	Dosage:	10 mg/kg*day						
	Administration:	ip, 27 days						
	Result:	Inhibited tumor growth.						
Solvent&Solubility	细胞实验:							
	DMSO 中的溶解度 : 200 mg/mL (601.68 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	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg			
			1 mM	3.0084 mL	15.0421 mL	30.0842 mL		
			5 mM	0.6017 mL	3.0084 mL	6.0168 mL		
			10 mM	0.3008 mL	1.5042 mL	3.0084 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								



	请您现用现配, 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: ≥ 5 mg/mL (15.04 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 5 mg/mL (15.04 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 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 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 5 mg/mL (15.04 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 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 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]. Hobson AD, et al. Identification of Selective Dual ROCK1 and ROCK2 Inhibitors Using Structure-Based DrugDesign. J Med Chem. 2018 Dec 27;61(24):11074-11100. [2]. Zhang W, et al., 3D-printing magnesium-polycaprolactone loaded with melatonin inhibits the development of osteosarcoma by regulating cell-in-cell structures. J Nanobiotechnology. 2021 Sep 4;19(1):263.

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	3.0084 mL	15.0421 mL	30.0842 mL	75.2106 mL
	5 mM	0.6017 mL	3.0084 mL	6.0168 mL	15.0421 mL
	10 mM	0.3008 mL	1.5042 mL	3.0084 mL	7.5211 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: shyyssw@sina.com

	15 mM	0.2006 mL	1.0028 mL	2.0056 mL	5.0140 mL
	20 mM	0.1504 mL	0.7521 mL	1.5042 mL	3.7605 mL
	25 mM	0.1203 mL	0.6017 mL	1.2034 mL	3.0084 mL
	30 mM	0.1003 mL	0.5014 mL	1.0028 mL	2.5070 mL
	40 mM	0.0752 mL	0.3761 mL	0.7521 mL	1.8803 mL
	50 mM	0.0602 mL	0.3008 mL	0.6017 mL	1.5042 mL
	60 mM	0.0501 mL	0.2507 mL	0.5014 mL	1.2535 mL
	80 mM	0.0376 mL	0.1880 mL	0.3761 mL	0.9401 mL
	100 mM	0.0301 mL	0.1504 mL	0.3008 mL	0.7521 mL



源叶