

Catalog Number: CM00252

产品信息

Catalog Number:
CM00252

CAS号:
105628-07-7

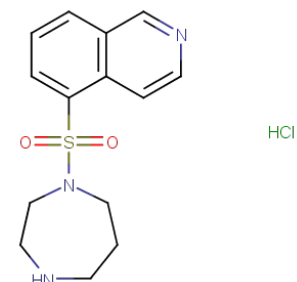
分子式:
C₁₄H₁₈ClN₃O₂S

主要靶点:
Autophagy|HIV
Protease|PKA|Calcium
Channel|Serine/threonin
kinase|ROCK|PKC

主要通路:
离子通道|蛋白酶体|代谢|表观遗传|
微生物学|干细胞|蛋白酪氨酸激酶|
细胞周期|细胞骨架|自噬

分子量:
327.83

溶解度:
DMSO:24.6 mg/mL (75
mM),H₂O:32.8 mg/mL (100 mM)



靶点活性

MLCK:55 μM(ki)|ROCK1:0.33 μM(ki)|PKA:1.0 μM(ki)|PKC:9.3 μM(ki)

体外活性

静脉注射0.01,0.03,0.1和0.3 mg/kg Fasudil剂量依赖性地降低MBP,提高HR,VBF,CBF,RBF和FBF.总剂量为1.0 ng/mL的 Fasudil提高心脏的输出量.通过冠状动脉内注射给实验狗30 μg Fasudil导致CBF增加约50%.口服Fasudil (剂量为100 mg/kg/天)显著降低用PLP p139-151免疫的SJL/J小鼠中EAE的发病率和平均最大临床评分.Fasudil抑制小鼠脾细胞对抗原的增殖反应.Fasudil处理显示心血管疾病的保护作用,并减少JNK的激活和减少AIF在缺血性损伤下的线粒体核移位.

体内活性

Fasudil诱导肌动蛋白纤维解体,且抑制细胞迁移。Fasudil竞争性抑制Ca²⁺诱导的去极化兔主动脉收缩。Fasudil抑制对KCL,血清苯丙氨酸和前列腺素F_{2a}的收缩反应。Fasudil抑制肝星状细胞的扩散,应力纤维的形成和α-SMA的表达,且抑制细胞生长,但不诱导细胞凋亡。Fasudil抑制LPA诱导的ERK1/2,JNK和p38 MAPK磷酸化。Fasudil还通过抑制5-羟色胺,去甲肾上腺素,组胺,血管紧张素和多巴胺诱导的螺旋条收缩来发挥血管舒张作用。

描述

Fasudil hydrochloride (HA-1077) is a potent inhibitor of ROCK1, PKA, PKC, and MLCK with Ki of 0.33 μM, 1.0 μM, 9.3 μM and 55 μM, respectively.

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 2 years