

Hydroxyfasudil 羟基法舒地尔

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53087ES08	5 mg
Hydroxyfasudil 羟基法舒地尔	53087ES10	10 mg
	53087ES50	50 mg

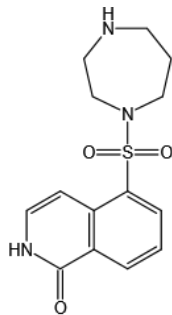
产品描述

Hydroxyfasudil (HA-1100, HA1100), 又称羟基法舒地尔, 是 fasudil hydrochloride 的活性代谢物, 是 ATP 竞争性、可逆的 ROCK 特异性抑制剂, 作用于 ROCK1/2 的 IC₅₀ 值分别为 0.73 μM 和 0.72 μM。Hydroxyfasudil 也能抑制中性粒细胞迁移, 在体内表现出血管扩展剂的作用。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Hydroxyfasudil, HA-1100, HA1100
中文名称 (Chinese Name)	羟基法舒地尔
靶点 (Target)	ROCK1/2
通路 (Pathway)	Cell Cycle/DNA Damage--ROCK
CAS 号 (CAS NO.)	105628-72-6
分子式 (Formula)	C ₁₄ H ₁₇ N ₃ O ₃ S
分子量 (Molecular Weight)	307.37
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥ 98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

Hydroxyfasudil 轻微抑制 PKA 活性, IC₅₀ 为 37 μM。Hydroxyfasudil 增加 eNOS mRNA 和蛋白水平, EC₅₀ 值为 0.8±0.3 μM。Hydroxyfasudil (0-100 μM) 浓度依赖性地增加 eNOS 活性并刺激人主动脉内皮细胞中的 NO 产生。Hydroxyfasudil (10 μM) 将 eNOS mRNA 的半衰期从 13 h 增加到 16 h, 但在浓度为 0.1 到 100 μM 时不影响 eNOS 启动子活性。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

在环磷酸胺(CYP)诱导的膀胱炎大鼠模型中, 腹腔注射 Hydroxyfasudil (10 mg/kg) 显著增加大鼠的平均和最大排尿量, 降低了最大膀胱逼尿肌压力。^[2] 在自发性自发性高血压大鼠模型中, 腹腔注射 Hydroxyfasudil (3 或 10 mg/kg), 以剂量依赖性方式显著改善了阴茎 cGMP 浓度的降低、Rho 激酶活性的增加、去甲肾上腺素诱导的收缩增加和乙酰胆碱诱导的松弛减少, 改善与高血压相关的 NO 诱导的海绵体平滑肌松弛功能障碍。^[3]

参考文献

- [1]. Rikitake Y, et al. Inhibition of Rho kinase (ROCK) leads to increased cerebral blood flow and stroke protection. *Stroke*. 2005 Oct;36(10):2251-7.
- [2]. Masago T, et al. Effect of the rho-kinase inhibitor hydroxyfasudil on bladder overactivity: an experimental rat model. *Int J Urol*. 2009 Oct;16(10):842-7.
- [3]. Saito M, et al. Hydroxyfasudil ameliorates penile dysfunction in the male spontaneously hypertensive rat. *Pharmacol Res*. 2012 Oct;66(4):325-31.