

## Fasudil 法舒地尔

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
Fasudil 法舒地尔	53040ES60	100 mg
	53040ES72	250 mg
	53040ES76	500 mg

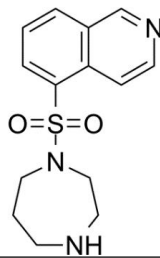
### 产品描述

Fasudil (法舒地尔) 是一种非特异性 ROCK 抑制剂, 对 ROCK1 的  $K_i$  值为  $0.33 \mu\text{M}$ 。Fasudil 也可抑制蛋白激酶的活性, PKA、PKC 和 PKG 的  $\text{IC}_{50}$  值分别为  $4.58 \mu\text{M}$ 、 $12.30 \mu\text{M}$  和  $1.650 \mu\text{M}$ 。同时, Fasudil 也是一种有效的  $\text{Ca}^{2+}$  通道拮抗剂。Fasudil 是一种有效的 Rho 激酶抑制剂和血管扩张剂, 自被发现以来, 它已被用于治疗脑血管痉挛, 这通常是由于蛛网膜下腔出血, 以及改善中风患者的认知能力下降。目前已发现 Fasudil 对治疗肺动脉高压有效。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	HA-1077, AT877; 5-((1,4-diazepan-1-yl) sulfonyl) isoquinoline
中文名称 (Chinese Name)	法舒地尔
靶点 (Target)	ROCK, PKG, PKA, PKC
通路 (Pathway)	Cell Cycle/DNA Damage--ROCK
CAS 号 (CAS NO.)	103745-39-7
分子式 (Formula)	$\text{C}_{14}\text{H}_{17}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}$
分子量 (Molecular Weight)	291.37
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
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  $-20^{\circ}\text{C}$ , 有效期 2 年。建议分装后  $-20^{\circ}\text{C}$  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）

Fasudil 是一种 ROCK 抑制剂，研究其对大鼠 HSCs 和人 HSC 衍生的 TWNT-4 细胞细胞生长、胶原生成和胶原酶活性的影响。研究发现：Fasudil (100  $\mu$ M)可抑制细胞增殖、应激纤维的形成和 $\alpha$ -SMA 的表达，同时抑制细胞生长，但不诱导细胞凋亡。Fasudil (100  $\mu$ M) 抑制 LPA 诱导的 ERK1/2、JNK 和 p38 MAPK 的磷酸化，抑制率分别为 60%、70%和 90%。Fasudil (100  $\mu$ M) 可抑制胶原和 TIMP 的生成和转录，刺激 MMP-1 的生成和转录，增强胶原酶的活性。Fasudil 在 100  $\mu$ M 时，使胶原积累减少了大约 80%，胶原酶活性大约增加了三倍，MMP-1 生成增加了大约 8 倍，使 TIMP 的生成减少了大约 80%。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

腹腔注射 Fasudil 可显著降低 PLP p139-151 (pb 0.05)免疫 SJL/J 小鼠 EAE 的发生率。与 PBS 处理的小鼠(pb 0.05)相比，Fasudil 处理的小鼠在第 19 天和第 22-35 天的病情严重程度显著降低。所有对照小鼠都有神经功能障碍，而只有 54.5%口服 Fasudil (100 mg/kg/day)治疗的小鼠出现了相对温和的 EAE。与对照组(pb 0.05)相比，口服 Fasudil 24 天后 EAE 的发生率和严重程度显著降低。Fasudil 还可抑制小鼠脾细胞对抗原的增殖反应。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

- [1]. Fukushima M, et al. Fasudil hydrochloride hydrate, a Rho-kinase (ROCK) inhibitor, suppresses collagen production and enhances collagenase activity in hepatic stellate cells. *Liver Int.* 2005 Aug;25(4):829-38.
- [2] Sun X, et al. The selective Rho-kinase inhibitor Fasudil is protective and therapeutic in experimental autoimmune encephalomyelitis. *J Neuroimmunol.* 2006 Nov;180(1-2):126-34. Epub 2006 Sep 22.