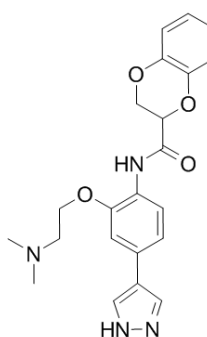


**SR3677 ; SR-3677**

产品编号：MB0264  
 质量标准：>98%,BR  
 包装规格：5MG；25MG  
 产品形式：白色至淡棕色粉末

**基本信息**

分子式	C22H24N4O4	结 构 式  
分子量	408.5	
CAS No.	1072959-67-1	
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥	
溶解性 (25°C)	DMSO 30 mg/mL DMF 30mg/ml Ethanol 5 mg/mL	
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。	
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。	

**简介：**SR-3677 是高效的选择性的 ROCK-II 抑制剂，IC50 值为~3 nM.

**别名：**1,4-Benzodioxin-2-carboxamide,  
 N-[2-[2-(dimethylamino)ethoxy]-4-(1H-pyrazol-4-yl)phenyl]-2,3-dihydro

**物理性状及指标：**

外观：.....白色至淡棕色粉末  
 UVλmax：.....275, 301 nm  
 溶解性：..... DMSO 30 mg/mL；DMF 30mg/ml；Ethanol 5 mg/mL  
 纯度：..... >98%,BR

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

**生物活性及研究进展**

Rho 激酶在不同疾病条件下表达并参与介导血管收缩和血管重塑的发病机制。Rho 激酶有两种亚型，即 ROCK I 和 ROCK II，由于分布上的差异而负责不同的生理功能，但结构几乎相似。Rho 激酶 2 属于 AGC 家族，广泛分布于脑，心脏和肌肉中。它通过钙敏化负责血管平滑肌的收缩。其缺陷和不需要的表达可导致许多医学症状，如多发性硬化症，心肌缺血，炎症反应等。SR-3677 是一种非常有效的选择性 ROCK 抑制剂，与 ROCK I (IC50 = 56 nM) 相比，对 ROCK II 具有更高的效力。

<b>产品描述</b>	SR-3677 是高效的选择性的 ROCK-II 抑制剂，IC50 值为~3 nM.	
<b>靶点</b>	ROCK-II	ROCK-I
	3 nM (IC <sub>50</sub> )	56 nM (IC <sub>50</sub> )

<b>体外研究</b>	SR-3677 在基于酶和细胞的测定中具有约 3nM 的 IC <sub>50</sub> ，对 353 种激酶具有 1.4% 的脱靶命中率，并且仅抑制 70 种非激酶酶和受体中的 3 种。SR-3677 对于 ROCK-I 的 IC <sub>50</sub> 值是 56±12nM。苯并二恶烷苯环与口袋疏水表面的疏水相互作用是促成 SR-3677 的高效力的主要因素
<b>体内研究</b>	药理学研究表明，SR-3677 在增加猪眼中的房水外流和抑制肌球蛋白轻链磷酸化方面都是有效的。连续暴露 25μM SR-3677 可使灌注 1 h 时的流出量增加 60%，2-5 h 时间点增加至 70-80%。

**美仑相关产品推荐**

MB4012	GSK429286A
MB4013	RKI-1447
MB4011	Thiazovivin
MB4010	Y-27632 2HCl

**用途及描述：**科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。SR-3677 是一种非常有效的选择性 ROCK 抑制剂，与 ROCK I (IC<sub>50</sub> = 56 nM) 相比，对 ROCK II 具有更高的效力 (IC<sub>50</sub> = 3 nM)。在激酶筛选小组中，3μM SR 3677 仅抑制 353 种激酶中的 5 种 (Akt3, Clk1, Clk2, Clk4, Lats2)，抑制率大于 50%。SR 3677 有效抑制肌球蛋白轻链磷酸化并增加猪眼中的房水外流青光眼治疗的离体模型。

**储液配置**

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4483 mL	12.2414 mL	24.4828 mL
5 mM	0.4897 mL	2.4483 mL	4.8966 mL
10 mM	0.2448 mL	1.2241 mL	2.4483 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	使用来自 Cisbio 的 STK2 激酶系统进行测定。在 STK 缓冲液中加入 5μL 1μM STK2 底物和 ATP (ROCK-I : 4μM; ROCK-II : 20μM) 的混合物至孔中。分配 20nL 测试化合物 (SR-3677)。通过加入 5μL 2.5nM 开始反应。STK 缓冲液中的 ROCK-I 或 0.5 nM ROCK-II。在室温 4 小时后，通过加入 10μL 1x 抗体和 62.5nM Sa-XL 在检测缓冲液中终止反应
-------------	--

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

## 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

### 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。