

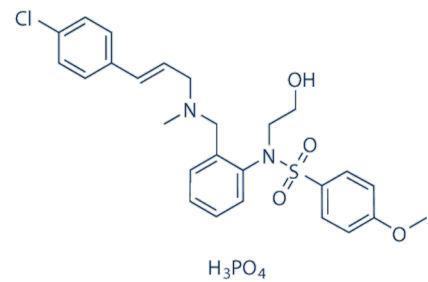
KN-93 Phosphate (CaMK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD9536-10mM	KN-93 Phosphate (CaMK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD9536-5mg	KN-93 Phosphate (CaMK抑制剂)	5mg
SD9536-25mg	KN-93 Phosphate (CaMK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-[2-[[[(E)-3-(4-chlorophenyl)prop-2-enyl]-methylamino]methyl]phenyl]-N-(2-hydroxyethyl)-4-methoxybenzenesulfonamide;phosphoric acid
简称	KN-93 Phosphate
别名	KN 93 phosphate, AOB6847, AKOS024256532, 4CA-0698, BC600417
中文名	N/A
化学式	C ₂₆ H ₂₉ ClN ₂ O ₄ S.H ₃ O ₄ P
分子量	599.03
CAS号	1188890-41-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water 92mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.83ml DMSO, 或每5.99mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD9536-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	KN-93 H ₃ PO ₄ 是一种强效的特异性的Ca ²⁺ /calmodulin-dependent protein kinase II (CaMKII)抑制剂, 其K _i 为0.37μM, 对APK、PKC、MLCK或Ca ²⁺ -PDE没有明显的抑制活性。				
信号通路	Neuronal Signaling				
靶点	CaMKII	—	—	—	—
IC ₅₀	0.37μM(K _i)	—	—	—	—
体外研究	KN-93抑制PC12h细胞中多巴胺的形成, 通过调整TH的反应率, 以减少Ca(2+)介导的TH分子磷酸化水平。KN-93抑制血清诱导的成纤维细胞生长, IC ₅₀ 为8μM, 并在延长的G1期阻滞诱导细胞凋亡。在Pca 细胞中, KN-93抑制雄激素受体活性和p53单独诱导的细胞死亡。				
体内研究	在患帕金森病的大鼠模型中, KN-93(5微克)通过降低pGluR1S845的表达改善左旋多巴诱发的异动症。在MRL/lpr Foxp3-GFP小鼠体内, KN-93引起脾脏, 外周淋巴结和外周血中显著的调节性T细胞感应, 并减少皮肤和肾脏损害。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	CaMKII的活性利用syntideII作为底物测定。纯化的CaMKII在测试混合物(35mM Hepes-Na(pH 8.0), 10mM MgCl ₂ , 0.5μM CaM, 5μM ATP, 1mM CaCl ₂ 或1mM EGTA, 总体积25微升)中于30°C下预培养2分钟。预培养后, 将蛋白质底物/放射性ATP混合物加入相同的试管中, 将预培养物进一步在30°C下培养5分钟(最终试验条件: 35mM Hepes-Na(pH 8.0), 10mM MgCl ₂ , 0.125μM CaCl ₂ , 20μM syntideII, 11.25μM [γ-32P]ATP, 10% DMSO和指示浓度的KN-93, 用0.25mM CaCl ₂ 和2mM EGTA(自动磷酸化样品)或0.25mM EGTA和2mM CaCl ₂ (非自动磷酸化样品)增补, 总体积为100微升)。该反应通过加入25微升100% (w/v)冰预冷的TCA终止。离心后, 将80微升上清液涂覆到磷酸纤维素纸上。然后用75mM H ₃ PO ₄ 在连续搅动下洗涤过滤器。洗涤4次后, 残留在滤纸上的放射性在液体闪烁计数器上测定。

细胞实验

细胞系	NIH 3T3成纤维细胞
浓度	~24 μ M
处理时间	70小时
方法	NIH3T3成纤维细胞在含DMEM和胎牛血清的聚苯乙烯皿中培养，在37°C，5% CO ₂ 加湿的房间用青霉素/链霉素进行增补。细胞的生长通过MTT色素还原法测定。

动物实验	
动物模型	Sprague Dawley雌性大鼠
配制	4微升包含0.02%抗坏血酸的0.9%生理盐水
剂量	~5微克
给药方式	纹状体内给药

➤ **参考文献:**

1. Sumi M, et al. Biochem Biophys Res Commun. 1991, 181(3), 968-975.
2. Tombes RM, et al. Cell Growth Differ. 1995, 6(9), 1063-1070.
3. Rokhlin OW, et al. Cancer Biol Ther. 2010, 9(3), 224-235.
4. Yang X, et al. Neuropsychiatr Dis Treat. 2013, 9, 1213-1220.
5. Koga T, et al. Autoimmunity. 2014, 15, 1-6.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD9536-10mM	KN-93 Phosphate (CaMK抑制剂)	10mM×0.2ml
SD9536-5mg	KN-93 Phosphate (CaMK抑制剂)	5mg
SD9536-25mg	KN-93 Phosphate (CaMK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：

<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01