

## KN 93 Phosphate ; KN-93 Phosphate

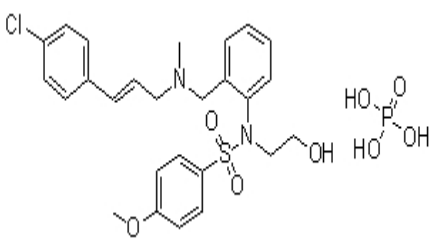
产品编号：MB4187

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C <sub>26</sub> H <sub>29</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>4</sub> S.H <sub>3</sub> PO <sub>4</sub>	结 构 式	
分子量	599.03		
CAS No.	1188890-41-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：100 mg/mL (166.93 mM)		
	Water：92 mg/mL (153.58 mM)		
	Ethanol：Insoluble		
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：**KN-93 H<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> 是一种强效的特异性的 Ca<sup>2+</sup>/calmodulin-dependent protein kinase II (CaMKII)抑制剂。

**别名：**Benzenesulfonamide, N-[2-[[[(2E)-3-(4-chlorophenyl)-2-propen-1-yl]methylamino]methyl]phenyl]-N-(2-hydroxyethyl)-4-methoxy-, phosphate (1:1)

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：100 mg/mL (166.93 mM)；Water：92 mg/mL (153.58 mM)；Ethanol：Insoluble

含量：.....>98%

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	KN-93 H <sub>3</sub> PO <sub>4</sub> 是一种强效的特异性的 Ca <sup>2+</sup> /calmodulin-dependent protein kinase II (CaMKII)抑制剂，其 K <sub>i</sub> 为 0.37 μM,对 APK, PKC, MLCK 或 Ca <sup>2+</sup> -PDE 没有明显的抑制活性。
靶点	CaMKII(Cell-free assay) 0.37 μM(K <sub>i</sub> )
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 <sup>2+</sup> 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 <sub>50</sub> 为 8 μM，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。

**美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)**

MB4196	KN-62
MB4213	STO-609

**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。KN-93 H<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> 是一种强效的特异性的 Ca<sup>2+</sup>/calmodulin-dependent protein kinase II (CaMKII)抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.6694 mL	8.3468 mL	16.6937 mL
5 mM	0.3339 mL	1.6694 mL	3.3387 mL
10 mM	0.1669 mL	0.8347 mL	1.6694 mL
50 mM	0.0334 mL	0.1669 mL	0.3339 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>自动磷酸化的/非自动磷酸化的 CaMKII 的活性测定:</b></p> <p>CaMKII 的活性利用 syntideII 作为底物测定。纯化的 CaMKII 在测试混合物( 35 mM HEPES-Na ( pH 8.0 ) , 10 mM MgCl<sub>2</sub> , 0.5 μM CaM , 5 μM ATP , 1 mM CaCl<sub>2</sub> 或 1 mM 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: 35 mM HEPES-Na ( pH 8.0 ) , 10 mM MgCl<sub>2</sub> , 0.125 μM CaCl<sub>2</sub> , 20 μM syntideII , 11.25 μM [ γ-<sup>32</sup>P] ATP , 10 % DMSO 和指示浓度的 KN-93 , 用 0.25 mM CaCl<sub>2</sub> 和 2 mM EGTA (自动磷酸化样品) 或 0.25 mM EGTA 和 2 mM CaCl<sub>2</sub> (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 75 mM H<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> 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。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> NIH 3T3 成纤维细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> ~24 μM</p> <p><b>Incubation Time:</b> 70 小时</p> <p><b>Method:</b> 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<sub>2</sub> 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。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> Sprague Dawley 雌性大鼠</p> <p><b>Formulation:</b> 4 微升包含 0.02% 抗坏血酸的 0.9% 生理盐水</p> <p><b>Dosages:</b> ~5 微克</p> <p><b>Administration:</b> 纹状体内给药</p>

**【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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。