

## H-89; H89 2HCl

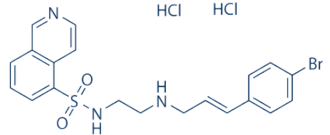
产品编号: MB5403

质量标准: >98%, PKA 抑制剂

包装规格: 10MG; 50MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C <sub>20</sub> H <sub>24</sub> BrCl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	结 构 式	
分子量	519.28		
CAS No.	130964-39-5		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 104 mg/mL (200.27 mM) Water: 6mg/mL 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:** H-89 dihydrochloride 是蛋白激酶 A (PKA) 抑制剂, 也可轻微抑制 PKG, PKC, 酪蛋白激酶活性。

**别名:** Protein kinase inhibitor H-89 dihydrochloride; 5-Isoquinolinesulfonamide,

N-[2-[[3-(4-bromophenyl)-2-propen-1-yl]amino]ethyl]-, hydrochloride (1:2)

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至类白色固体

溶解性: .....DMSO: 104 mg/mL (200.27 mM); Water: 6mg/mL; Ethanol: Insoluble

含量: .....>98%

**储存条件:** -20℃, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	H89 2HCl 是一种有效的 PKA 抑制剂, 无细胞试验中 Ki 为 48 nM, 作用于 PKA 比作用于 PKG 选择性高 10 倍, 比作用于 PKC, MLCK, 钙调蛋白激酶 II 和酪蛋白激酶 I/II 选择性高 500 倍。
靶点	PKA(cell-free assay),48nM(Ki); S6K <sub>1</sub> (cell-free assay),80nM
体外研究	H89 2HCl 是一个有效的 PKA (cAMP 依赖性)蛋白激酶 A 抑制剂, Ki 值为 48 nM, 选择性比 PKG 高 10 倍, 比 PKC, MLCK, 钙调蛋白激酶 II 和酪蛋白激酶 I / II 高 500 多倍。加入 forskolin 之前细胞用 H-89 (30 μM)预处理 1 小时, 会剂量依赖性显著抑制 forskolin 诱导的蛋白磷酸化。H89 也会抑制几种其他的激酶, 对 S6K1, MSK1, PKA, ROCKII, PKBα 以及 MAPKAP-K1b 的 IC50 值分别为 80, 120, 135, 270, 2600 和 2800 nM。H89 对一些细胞受体和离子通道, 包括 Kv1.3 K <sup>+</sup> 通道, β1AR 和 β2AR 也具有活性。
体内研究	H89 导致蛋白磷酸化明显的变动, 其中磷酸化作用变化最大的是左旋糖-1,6-二磷酸酶, 异构核糖核蛋白(hnRNP), NSFL1 辅因子 P47, 所有这些都与 cAMP/PKA 具有潜在的调控联系。

### 美仑相关产品推荐

MB11769	蛋白激酶 A 调节亚基 II 底物
MB11768	蛋白激酶 A 抑制剂底物

**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。H-89 dihydrochloride 是蛋白激酶 A (PKA) 抑制剂，也可轻微抑制 PKG, PKC，酪蛋白激酶活性，本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置：**

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9257 mL	9.6287 mL	19.2574 mL
5 mM	0.3851 mL	1.9257 mL	3.8515 mL
10 mM	0.1926 mL	0.9629 mL	1.9257 mL
50 mM	0.0385 mL	0.1926 mL	0.3851 mL

**经典实验操作（仅供参考）**

<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> PC12D  <b>Concentrations:</b> ~30 μM  <b>Incubation Time:</b> 1 h  <b>Method:</b>            细胞内 cAMP 水平的测定。在培养 48 小时后，PC12D 细胞接种于包含 30 μM H-89 的测试培养基培养 1 小时，然后暴露于包含 10 μM forskolin 和 30 μM H-89 的新鲜培养基。将细胞用橡胶刮帚刮下，在 0.5 ml 6%三氯乙酸存在下超声处理。为提取出三氯乙酸，加入 2mL 石油醚，使制剂混合，在 3000 rpm 下离心 10 分钟。将上层抽吸后，残余样品溶液用于测定。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 大鼠  <b>Formulation:</b> 溶解于 100%DMSO，在 1:20 的 0.9%无菌生理盐水中稀释  <b>Dosages:</b> 20 或 200 mg/kg  <b>Administration:</b> s.c.</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。如需制备储备液，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。