

HB221109

H 89 2HCl (H89 dihydrochloride)

产品信息

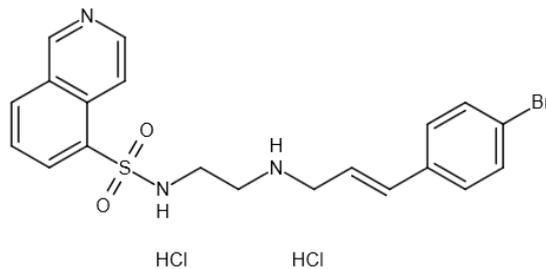
产品名称	产品编号	规格
H 89 2HCl (H89 dihydrochloride)	50603ES10	10 mg
	50603ES50	50 mg

产品描述

H-89, Dihydrochloride 又称为 H 89 2HCl, 是一种有效的、细胞通透性蛋白激酶 A (PKA) 抑制剂, K_i 值为 48 nM, 通过与 ATP 竞争性结合 PKA 催化亚基, 抑制 PKA 磷酸化作用。H-89, Dihydrochloride 还可抑制 S6K1、MSK1、ROCK-II、PKB α 和 MAPKAP-K1b 等激酶活性, IC_{50} 依次为 80、120、270、2600 和 2800 nM。另外, H-89, Dihydrochloride 对一些细胞受体和离子通道也具有活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	(E)-N-(2-(4-bromocinnamylamino)ethyl)isoquinoline-5-sulfonamide dihydrochloride; H 89 2HCl; H-89 dihydrochloride; H89 Dihydrochloride; H 89; Protein kinase inhibitor H-89 dihydrochloride
中文名称 (Chinese Name)	H-89 双盐酸盐
靶点 (Target)	PKA
CAS 号 (CAS NO.)	130964-39-5
分子式 (Formula)	$C_{20}H_{20}BrN_3O_2S \cdot 2HCl$
分子量 (Molecular Weight)	519.28
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: ≥ 50 mg/mL, 不溶于水和乙醇
结构式 (Structure)	



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 $-20^{\circ}C$, 保持干燥, 有效期 3 年。易溶于 DMSO。建议分装后 $-20^{\circ}C$ 避光保存, 避免反复冻融。

注意事项

- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 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）

为了检测 H-89, Dihydrochloride 是如何抑制 PKA 的, 在培养 48 h 后, PC12D 细胞使用含有不同浓度 H-89, Dihydrochloride (0, 20, 30 μ M) 培养液预培养细胞 1 h, 然后添加含有 10 μ M forskolin 新鲜培养基孵育 1 h 后, 检测放射性 P 标记磷酸化蛋白, 发现 H-89, Dihydrochloride 可剂量依赖性抑制 forskolin 诱导的蛋白磷酸化。同时, H-89, Dihydrochloride 不会影响 cAMP 积累和 AC 活性, 以上说明 H-89, Dihydrochloride 是直接抑制 PKA 活性的。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

在体内检测 H-89, Dihydrochloride 对 A β 沉积的影响, 使用 8 周大 PDAPP (APP_{717V-F}) 转基因小鼠模型, 每只小鼠通过脑前窗旁的侧脑室给药 H-89, Dihydrochloride (103 μ M; 5 mL), 给药 3 h 后, 解剖小鼠取脑部海马体(阿尔茨海默症 Alzheimer's disease 病程中脑部主要影响区域), ELISA 检测 A β 含量, 结果显示 A β 沉积减少。^[2]

参考文献

- [1]. Chijiwa T, et al. Inhibition of forskolin-induced neurite outgrowth and protein phosphorylation by a newly synthesized selective inhibitor of cyclic AMP-dependent protein kinase, N-[2-(p-bromocinnamylamino)ethyl]-5-isoquinolinesulfonamide (H-89), of PC12D pheochromocytoma cells. *J Med Chem* 265(9): 5267-5272 (1990) .
- [2]. Su, Y., et al. Inhibition of Abeta production and APP maturation by a specific PKA inhibitor. *FEBS Lett* 546(2-3):407-410(2003).