

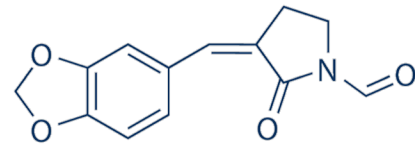
KNK437 (HSP抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC6659-10mM	KNK437 (HSP抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6659-5mg	KNK437 (HSP抑制剂)	5mg
SC6659-25mg	KNK437 (HSP抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	3-(1,3-benzodioxol-5-ylmethylidene)-2-oxopyrrolidine-1-carbaldehyde
简称	KNK437
别名	KNK 437, KNK-437
中文名	N/A
化学式	C ₁₃ H ₁₁ NO ₄
分子量	245.23
CAS号	218924-25-5
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 15mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入2.04ml DMSO, 或每2.45mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC6659-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	KNK437是一种泛-HSP抑制剂, 其抑制诱导型HSPs, 包括 HSP105、HSP72和HSP40的合成。				
信号通路	Cell Cycle; Cytoskeletal Signaling; Metabolism				
靶点	HSP105	HSP72	HSP40	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	在COLO 320DM(人结肠癌)细胞中, KNK437可剂量依赖性地抑制获得耐热性和各HSPs的活性, 包括Hsp105、HSP70和HSP40。在PC-3细胞中, KNK437和槲皮素剂量依赖性地抑制耐热性。在PC-3和LNCaP细胞中, KNK437降低热诱导的HSP70 mRNA和蛋白的积累。				
体内研究	KNK437(200mg/kg, 腹腔注射)没有显示出抗肿瘤效应, 且不增加非耐受肿瘤的温敏性。相同剂量的KNK437可协同提高分级热处理的抗肿瘤功效。				
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	接种COLO 320DM细胞(200000个)至12孔板培养两天, 加入KNK437处理1h后, 进行热处理。细胞经42°C或37°C处理90min后, 继续37°C培养2h。代谢标记, 细胞经不含Ca ²⁺ 和Mg ²⁺ 的PBS洗涤后, 加入1.22MBq [³⁵ S]甲硫氨酸(溶于含有10%胎牛血清的DMEM培养基)孵育1h。代谢标记细胞后, 细胞经PBS洗涤两次后, 加入裂解缓冲液(1% NP40、0.15M NaCl、50mM Tris-HCl (pH 8.0)、5mM EDTA和蛋白酶抑制剂(0.2mM 4-(2-氨基乙基)苯磺酰氟盐酸盐、2mM N-乙基马来酰亚胺、1μg/ml胃蛋白酶抑制剂和1μg/ml亮肽素))裂解。经12000g离心20min后, 含有等量氯乙酸不溶放射性的细胞提取物通过二维凝胶电泳分析(一维凝胶电泳为非平衡pH梯度凝胶电泳, 二维凝胶电泳为10% SDS-PAGE)。

细胞实验	
细胞系	COLO 320DM细胞
浓度	100μM
处理时间	1h
方法	耐热性是将细胞与300μM亚砷酸钠孵育90min后诱导形成的。诱导前, 细胞先经或不经100μM KNK437处理1h。亚砷酸钠处理细胞后, 细胞用PBS洗一次, 在37°C分别经或不经KNK437处理5h。KNK437对耐

	热性的影响是经45°C加热细胞一定时间后测定的。细胞存活率以各组与未处理对照细胞的电泳效率比表示。
--	---

动物实验	
动物模型	C3H/He小鼠
配制	橄榄油
剂量	200mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Yokota S, et al. Cancer Res. 2000, 60(11), 2942-2948.
- 2.Sahin E, et al. Int J Hyperthermia. 2011, 27(1), 63-73.
- 3.Koishi M, et al. Clin Cancer Res. 2001, 7(1), 215-219.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC6659-10mM	KNK437 (HSP抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6659-5mg	KNK437 (HSP抑制剂)	5mg
SC6659-25mg	KNK437 (HSP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:

- 本产品对人体有毒，操作时请特别小心，并注意有效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的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