



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **2-AMINO-BETA-NAPHTHOTHIAZOLE; SKA-31**

CAS 号: **40172-65-4**

产品货号: **S87846**

生物活性:

Description	SKA-31 是钾离子通道 (potassium channel) 激活剂, 作用于 KCa3.1, KCa2.2, KCa2.1 和 KCa2.3 的 EC50 值分别为 260 nM, 1.9 μ M, 2.9 μ M, 2.9 μ M, 能增强内皮源性超极化因子反应, 降低血压。																																		
IC50 & Target	EC50: 2.9 μ M (KCa2.1), 1.9 μ M (KCa2.2), 2.9 μ M (KCa2.3), 260 nM (KCa3.1)[1].																																		
In Vitro	SKA-31 比 PK 26124 (HY-B0211) 更有效地激活 KCa2/3 通道, 并且比其他离子通道更具选择性 [1]。 SKA-31 在 HCT-116 细胞和 HCT-8 细胞中的 IC50s 分别为 5.3 μM 和 46.9 μM[2]。br/>SKA-31 (5.3 μM; 0-96 小时) 在零时间以 5.3 μM 添加时, 可减少 HCT-116 细胞增殖[2]。 SKA-31 在 5 μM 触发 HCT-116 细胞凋亡, 45 μM 对 HCT-8 细胞作用较小[2]。 SKA-31 增加 G0/G1 期细胞百分比 HCT-116 和 HCT-8 细胞系的浓度分别为 5 μM 和 45 μM[2]。 SKA-31 进一步激活 Caspase 3 并减少 CDDP 诱导的 Akt 磷酸化[2]。 SKA-31 与 CDDP 对抑制 HCT-116 细胞增殖也有协同作用[2]。 Cell Viability Assay[2] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>HCT-116 cells, HCT-8 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td></td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Reduced cell viability with IC₅₀s of 5.3 μM, 46.9 μM in HCT-116 and HCT-8, respectively.</td></tr></table> Cell Proliferation Assay[2] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>HCT-116 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>5.3 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>0-96 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Reduced HCT-116 cells proliferation when added at time zero at IC₅₀s value.</td></tr></table> Apoptosis Analysis[2] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>HCT-116 cells, HCT-8 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>5 μM (HCT-116 cells), 45 μM (HCT-8 cells)</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Triggered apoptosis in HCT-116 cells, and the effect was smaller in HCT-8 cells.</td></tr></table> Cell Cycle Analysis[2] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>HCT-116 cells, HCT-8 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>5 μM (HCT-116), 45 μM (HCT-8)</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Increased the percentage of cells in G0/G1 phase in HCT-116 and HCT-8 cell lines.</td></tr></table> Western Blot Analysis[2] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>HCT-116 cells</td></tr></table>	Cell Line:	HCT-116 cells, HCT-8 cells	Concentration:		Incubation Time:	24 hours	Result:	Reduced cell viability with IC ₅₀ s of 5.3 μ M, 46.9 μ M in HCT-116 and HCT-8, respectively.	Cell Line:	HCT-116 cells	Concentration:	5.3 μ M	Incubation Time:	0-96 hours	Result:	Reduced HCT-116 cells proliferation when added at time zero at IC ₅₀ s value.	Cell Line:	HCT-116 cells, HCT-8 cells	Concentration:	5 μ M (HCT-116 cells), 45 μ M (HCT-8 cells)	Incubation Time:	24 hours	Result:	Triggered apoptosis in HCT-116 cells, and the effect was smaller in HCT-8 cells.	Cell Line:	HCT-116 cells, HCT-8 cells	Concentration:	5 μ M (HCT-116), 45 μ M (HCT-8)	Incubation Time:	24 hours	Result:	Increased the percentage of cells in G0/G1 phase in HCT-116 and HCT-8 cell lines.	Cell Line:	HCT-116 cells
Cell Line:	HCT-116 cells, HCT-8 cells																																		
Concentration:																																			
Incubation Time:	24 hours																																		
Result:	Reduced cell viability with IC ₅₀ s of 5.3 μ M, 46.9 μ M in HCT-116 and HCT-8, respectively.																																		
Cell Line:	HCT-116 cells																																		
Concentration:	5.3 μ M																																		
Incubation Time:	0-96 hours																																		
Result:	Reduced HCT-116 cells proliferation when added at time zero at IC ₅₀ s value.																																		
Cell Line:	HCT-116 cells, HCT-8 cells																																		
Concentration:	5 μ M (HCT-116 cells), 45 μ M (HCT-8 cells)																																		
Incubation Time:	24 hours																																		
Result:	Triggered apoptosis in HCT-116 cells, and the effect was smaller in HCT-8 cells.																																		
Cell Line:	HCT-116 cells, HCT-8 cells																																		
Concentration:	5 μ M (HCT-116), 45 μ M (HCT-8)																																		
Incubation Time:	24 hours																																		
Result:	Increased the percentage of cells in G0/G1 phase in HCT-116 and HCT-8 cell lines.																																		
Cell Line:	HCT-116 cells																																		



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	Concentration: Incubation Time: Result:	24 hours Further activated Caspase 3 and reduced Akt phosphorylation when co-treatment with CDDP in HCT-116 cells.			
In Vivo	SKA-31 没有急性毒性，具有良好的药代动力学特性[1]。 SKA-31 增强小鼠颈动脉内皮细胞中的天然 KCa3.1 和 KCa2.3，EC50 KCa3.1 和 KCa2.3 的值分别为 225 nM 和 1.6 μ M[1]。 SKA-31 刺激血管内皮细胞中的 KCa3.1 和 KCa2.3 并增加乙酰胆碱诱导的内皮衍生超极化因子 (EDHF) 介导的血管舒张[1]。 SKA-31 增强 EDHF 型血管舒张并降低小鼠的血压。注射 SKA-31 (1-30 mg/kg; ip) 可在 24 小时内降低血压正常的野生型小鼠的 MAP，但对 KCa3.1 (-/-) 小鼠 (-/-) 无影响[1]。				
	Animal Model:	16-25 weeks mice[1]			
	Dosage:	1 mg/kg, 10 mg/kg, and 30 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection			
	Result:	Lower MAP over 24 hours in normotensive wild-type mice but not in KCa3.1(-/-) mice (-/-).			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度：125 mg/mL (624.17 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响，请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	4.9934 mL	24.9668 mL	49.9336 mL
		5 mM	0.9987 mL	4.9934 mL	9.9867 mL
		10 mM	0.4993 mL	2.4967 mL	4.9934 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (12.48 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水				



	溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (12.48 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (10.39 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。
参考文献	[1]. Sankaranarayanan A, et al. Naphtho[1,2-d]thiazol-2-ylamine (SKA-31), a new activator of KCa2 and KCa3.1 potassium channels, potentiates the endothelium-derived hyperpolarizing factor response and lowers blood pressure. Mol Pharmacol. 2009 Feb;75(2):281-95. [2]. Serena Pillozzi, et al. The combined activation of KCa3.1 and inhibition of Kv11.1/hERG1 currents contribute to overcome CDDP resistance in colorectal cancer cells. Br J Cancer. 2018 Jan; 118(2): 200 – 212.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month。 -80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	4.9934 mL	24.9668 mL	49.9336 mL	124.8340 mL
	5 mM	0.9987 mL	4.9934 mL	9.9867 mL	24.9668 mL
	10 mM	0.4993 mL	2.4967 mL	4.9934 mL	12.4834 mL
	15 mM	0.3329 mL	1.6645 mL	3.3289 mL	8.3223 mL
	20 mM	0.2497 mL	1.2483 mL	2.4967 mL	6.2417 mL
	25 mM	0.1997 mL	0.9987 mL	1.9973 mL	4.9934 mL
	30 mM	0.1664 mL	0.8322 mL	1.6645 mL	4.1611 mL
	40 mM	0.1248 mL	0.6242 mL	1.2483 mL	3.1208 mL
	50 mM	0.0999 mL	0.4993 mL	0.9987 mL	2.4967 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	60 mM	0.0832 mL	0.4161 mL	0.8322 mL	2.0806 mL
	80 mM	0.0624 mL	0.3121 mL	0.6242 mL	1.5604 mL
	100 mM	0.0499 mL	0.2497 mL	0.4993 mL	1.2483 mL



源叶