



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: **NS-11021**
CAS 号: **956014-19-0**
产品货号: **S89252**

生物活性:				
Description	NS 11021 是一种有效特异性的 Ca^{2+} 激活的大电导 K^{+} (KCa1.1) 通道激活剂。当浓度高于 $0.3 \mu\text{M}$ 时, NS 11021 通过平行移动通道激活曲线产生更多负电位, 以浓度依赖的方式激活 KCa1.1 。			
IC50 & Target	Ca^{2+} -activated big-conductance K^{+} Channels[1]			
In Vitro	NS 11021 ($1-30 \mu\text{M}$) 在浓度为 $3 \mu\text{M}$ 时将 hKCa1.1 的电流从 $2 \mu\text{A}$ 增加到 $4 \mu\text{A}$, 并且可以在 <i>X. laevis</i> 卵母细胞中以剂量依赖的方式激活 hKCa1.1 通道。[1]。 NS 11021 ($3 \mu\text{M}$) 使通道的 hKCa1.1 电流增加 171%, 这会在开放和封闭结构之间反复转换, 同时增加 hKCa1。对于在 <i>X. laevis</i> 卵母细胞中保持闭合构象的通道, 电流增加了 187%[1]。 NS 11021 ($0-10 \mu\text{M}$) 可以浓度依赖性方式增强稳定表达 hKCa1.1 的单克隆 HEK293 细胞中的 hKCa1.1 电流[1]。 NS 11021 (5 或 $50 \mu\text{M}$) 在青蛙腓肠肌中对静息膜电位 (RMP) 没有影响, 同时以剂量依赖的方式显著增加动作电位 (AP) 上升时间。NS 11021 完全逆转过氧化氢对骨骼肌纤维 AP 复极化阶段的有害影响[2]。 NS 11021 ($1 \mu\text{M}$) 有效减轻大鼠肾近端肾小管上皮 (NRK) 细胞中 CS + RW (冷藏 (18 小时) 和复温 (2 小时)) 诱导的 mitoBK 通道损伤、线粒体呼吸功能障碍、去极化、超氧化物产生和细胞死亡[3]。			
In Vivo	NS 11021 ($1-30 \mu\text{M}$) 在浓度为 $3 \mu\text{M}$ 时将 hKCa1.1 的电流从 $2 \mu\text{A}$ 增加到 $4 \mu\text{A}$, 并且可以在 <i>X. laevis</i> 卵母细胞中以剂量依赖的方式激活 hKCa1.1 通道。[1]。 NS 11021 ($3 \mu\text{M}$) 使通道的 hKCa1.1 电流增加 171%, 这会在开放和封闭结构之间反复转换, 同时增加 hKCa1。对于在 <i>X. laevis</i> 卵母细胞中保持闭合构象的通道, 电流增加了 187%[1]。 NS 11021 ($0-10 \mu\text{M}$) 可以浓度依赖性方式增强稳定表达 hKCa1.1 的单克隆 HEK293 细胞中的 hKCa1.1 电流[1]。 NS 11021 (5 或 $50 \mu\text{M}$) 在青蛙腓肠肌中对静息膜电位 (RMP) 没有影响, 同时以剂量依赖的方式显著增加动作电位 (AP) 上升时间。NS 11021 完全逆转过氧化氢对骨骼肌纤维 AP 复极化阶段的有害影响[2]。 NS 11021 ($1 \mu\text{M}$) 有效减轻大鼠肾近端肾小管上皮 (NRK) 细胞中 CS + RW (冷藏 (18 小时) 和复温 (2 小时)) 诱导的 mitoBK 通道损伤、线粒体呼吸功能障碍、去极化、超氧化物产生和细胞死亡[3]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (195.60 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
		1 mM	1.9560 mL	9.7801 mL
		5 mM	0.3912 mL	1.9560 mL
		10 mM	0.1956 mL	0.9780 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.07 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.07 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Bo Hjorth Bentzen, et al. The small molecule NS11021 is a potent and specific activator of Ca²⁺-activated big-conductance K⁺ channels. Mol Pharmacol. 2007 Oct;72(4):1033-44 [2]. Cagil Coskun, et al. BK channel openers NS1619 and NS11021 reverse hydrogen peroxide-induced membrane potential changes in skeletal muscle. J Recept Signal Transduct Res. 2020 Oct;40(5):449-455. [3]. Stephen Shrum, et al. Specific BK Channel Activator NS11021 Protects Rat Renal Proximal Tubular Cells from Cold Storage-Induced Mitochondrial Injury In Vitro. Biomolecules. 2019 Dec 4;9(12):825.

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℃, 6 months; -20℃, 1 month。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 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	1.9560 mL	9.7801 mL	19.5603 mL	48.9007 mL
	5 mM	0.3912 mL	1.9560 mL	3.9121 mL	9.7801 mL
	10 mM	0.1956 mL	0.9780 mL	1.9560 mL	4.8901 mL
	15 mM	0.1304 mL	0.6520 mL	1.3040 mL	3.2600 mL
	20 mM	0.0978 mL	0.4890 mL	0.9780 mL	2.4450 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

	25 mM	0.0782 mL	0.3912 mL	0.7824 mL	1.9560 mL
	30 mM	0.0652 mL	0.3260 mL	0.6520 mL	1.6300 mL
	40 mM	0.0489 mL	0.2445 mL	0.4890 mL	1.2225 mL
	50 mM	0.0391 mL	0.1956 mL	0.3912 mL	0.9780 mL
	60 mM	0.0326 mL	0.1630 mL	0.3260 mL	0.8150 mL
	80 mM	0.0245 mL	0.1223 mL	0.2445 mL	0.6113 mL
	100 mM	0.0196 mL	0.0978 mL	0.1956 mL	0.4890 mL



源叶