



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: **H-7 inhibitor;Protein kinase inhibitor H-7**
CAS 号: **84477-87-2**
产品货号: **S89562**

生物活性:				
Description	Protein kinase inhibitor H-7 是一种选择性的 PKC 和环核苷酸依赖性蛋白激酶抑制剂, 其对兔蛋白激酶 C 的 Ki 值为 6.0 μM。对兔 cAMP 依赖性蛋白激酶的 Ki 值为 3.0 μM, 对猪 cGMP 依赖性蛋白激酶的 Ki 值为 5.8 μM。Protein kinase inhibitor H-7 不影响 Ca2+-钙调蛋白依赖性酶。Protein kinase inhibitor H-7 可调控 Actin 细胞骨架、抑制收缩性、破坏应力纤维、诱导突出活性、稳定细胞间连接, 并引发快速可逆的细胞骨架重组。Protein kinase inhibitor H-7 可用作阐明蛋白激酶 C 介导的信号系统作用的研究工具。			
IC50 & Target[1]	PKC	PKA	PKG	
	6 μM (Ki)	3 μM (Ki)	5.8 μM (Ki)	
In Vitro	Protein kinase inhibitor H-7 可强效且直接地抑制兔脑蛋白激酶 C (Ki = 6.0 μM) 和兔骨骼肌 cAMP 依赖性蛋白激酶 (Ki = 3.0 μM), 而对来自多个物种和组织的其他纯化蛋白激酶及 ATP 酶的活性较弱[1]。			
	Protein kinase inhibitor H-7 (10-50 μM; 2 min preincubation) 可剂量依赖性地抑制完整洗涤兔血小板中蛋白激酶 C 介导的 40K 蛋白磷酸化, 但即使在 50 μM 浓度下, 也不会抑制同一细胞系统中 Ca2+-钙调蛋白介导的 20K 蛋白磷酸化[2]。			
	Protein kinase inhibitor H-7 (100-300 μM) 可增强 Swiss 3T3 成纤维细胞和 SVT2 转化成纤维细胞的板状伪足突出活性并降低细胞极性, 表现为分散值显著升高、伸长值显著降低[3]。			
	Protein kinase inhibitor H-7 (300 μM; 10-30 min) 可破坏鸡晶状体细胞中的应力纤维及黏着斑相关蛋白 (肌球蛋白、纽蛋白、踝蛋白), 同时保留细胞间黏着连接, 且这些细胞骨架变化在去除 H-7 后可完全逆转[3]。			
	Protein kinase inhibitor H-7 (300 μM; 10-15 min pretreatment, or added during permeabilization/contraction) 在用作预处理时, 可强烈抑制 Saponin 透化的瑞士 3T3 成纤维细胞、鸡晶状体细胞和鸡胚胎成纤维细胞中由 ATP 诱导的收缩, 但在加入透化细胞时仅能微弱抑制收缩[3]。			
	Immunofluorescence[3]			
	Cell Line:	chick lens cells, Swiss 3T3 fibroblasts, chicken embryo fibroblasts		
	Concentration:	300 μM		
	Incubation Time:	10 min, 30 min; 30 min incubation followed by 3-60 min recovery		
	Result:	Caused rapid deterioration of actin-containing stress fibers and associated myosin, vinculin, and talin in focal contact sites within 10-30 min. Reorganized actin into short cytoplasmic bundles and lamellipodial protrusions. Retained actin, vinculin, and N-cadherin associated with cell-cell adherens junctions, with only minor increases in diffuse cytoplasmic N-cadherin staining. Reversed these effects upon removal: stress fibers reassembled within 3-10 min, with actin labeling augmented near adhesion sites, and the subcellular distribution of actin, myosin, vinculin, talin, and N-cadherin was restored within 60 min.		
	细胞实验:			



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: shyyysw@sina.com

Solvent&Solubility	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (343.19 mM; 超声助溶 (<60°C); 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	3.4319 mL	17.1597 mL	34.3194 mL
		5 mM	0.6864 mL	3.4319 mL	6.8639 mL
		10 mM	0.3432 mL	1.7160 mL	3.4319 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 (protect from light)。-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。				

参考文献

[1]. Hidaka H, et al. Isoquinolinesulfonamides, novel and potent inhibitors of cyclic nucleotide dependent protein kinase and protein kinase C. Biochemistry. 1984 Oct 9;23(21):5036-41.

[2]. Kawamoto S, et al. 1-(5-Isoquinolinesulfonyl)-2-methylpiperazine (H-7) is a selective inhibitor of protein kinase C in rabbit platelets. Biochem Biophys Res Commun. 1984;125(1):258-264.

[3]. Volberg T, et al. Effect of protein kinase inhibitor H-7 on the contractility, integrity, and membrane anchorage of the microfilament system. Cell Motil Cytoskeleton. 1994;29(4):321-338.

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 (protect from light)。-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	3.4319 mL	17.1597 mL	34.3194 mL	85.7986 mL
	5 mM	0.6864 mL	3.4319 mL	6.8639 mL	17.1597 mL
	10 mM	0.3432 mL	1.7160 mL	3.4319 mL	8.5799 mL
	15 mM	0.2288 mL	1.1440 mL	2.2880 mL	5.7199 mL
	20 mM	0.1716 mL	0.8580 mL	1.7160 mL	4.2899 mL
	25 mM	0.1373 mL	0.6864 mL	1.3728 mL	3.4319 mL
	30 mM	0.1144 mL	0.5720 mL	1.1440 mL	2.8600 mL
	40 mM	0.0858 mL	0.4290 mL	0.8580 mL	2.1450 mL
	50 mM	0.0686 mL	0.3432 mL	0.6864 mL	1.7160 mL
	60 mM	0.0572 mL	0.2860 mL	0.5720 mL	1.4300 mL
	80 mM	0.0429 mL	0.2145 mL	0.4290 mL	1.0725 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: shyysw@sina.com

	100 mM	0.0343 mL	0.1716 mL	0.3432 mL	0.8580 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶