CHIR98014；CHIR-98014

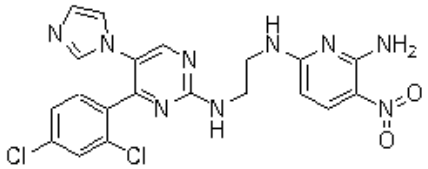
产品编号：MB3705

质量标准：>98%，有效的 GSK-3α/β抑制剂

包装规格：5MG;25MG;100MG

产品形式：粉状

基本信息

分子式	C20H17Cl2N9O2	结构式	
分子量	486.31		
CAS No.	252935-94-7		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：8 mg/mL warmed (16.45 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：CHIR-98014 是一种有效的，细胞通透的 GSK-3 抑制剂，可抑制 GSK-3α 和 GSK-3β 的活性，IC_{50} 值分别为 0.65 和 0.58 nM；CHIR-98014 对 cdc2 和 erk2 的作用较弱。

别名：*N*-6-[2-[[4-(2,4-Dichlorophenyl)-5-(1*H*-imidazol-1-yl)-2-pyrimidinyl]amino]ethyl]-3-nitro-2,6-pyridinediamine, CHIR-98014

物理性状及指标：

外观：.....白色至棕色粉末

溶解性：.....DMSO：8 mg/mL warmed (16.45 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	CHIR-98014 是一种有效的 GSK-3α/β抑制剂，无细胞试验中 IC50 为 0.65 nM/0.58 nM，作用于 GSK-3 比作用于其最密切的同源物 Cdc2 和 ERK2 选择性高。
靶点	GSK-3 β (Cell-free assay) | GSK-3 α (Cell-free assay)

	0.58 nM　0.65 nM
体外研究	CHIR 98014 抑制人类 GSK-3β，K_i 值为 0.87 nM。CHIR 98014 强有效抑制鼠 GSK-3。CHIR 98014 为 ATP 竞争性抑制剂,作用于抗 20 种其他蛋白激酶包括 CDC2, erk2, tie2，KDR 等的 GSK-3,选择性为 500 倍到 1000 倍以上。CHIR 98014 抑制 CDC2，IC50 为 3.7 μM。然而, CHIR 98014 作用于 GSK-3 高度同源的α和β亚型具有相似效果,但是在 GSK-3 和最接近的同系物 cdc2 和 erk2 间具有明显区别。用表达 CHO-IR 细胞或原代鼠肝细胞的胰岛素受体处理，提高 CHIR98014 浓度，导致 GS 活性上升 2 到 3 倍。CHIR 98014 使 CHO-IR 和鼠肝细胞达到半最大 GS 刺激反应的浓度分别为 106 和 107 nM。
体内研究	GSK-3 抑制剂 CHIR-98014 作用于从瘦弱的 Zucker 和抗胰岛素的 ZDF 鼠分离的 I 型骨骼肌，激活 GS 活性。从 ZDF 鼠分离的比目鱼肌明显抗 GS 激活的胰岛素，但是从瘦弱 Zucker 鼠分离的肌肉对 500 nM CHIR 98014 反应程度相同，都提高 40%。瘦弱 Zucker 鼠分离的肌肉中胰岛素和 CHIR 98014 激活的 GS 比 ZDF 鼠分离的肌肉中强很多。CHIR 98014 或胰岛素作用于这些细胞和肌肉不会改变全部 GS 活性。 同时, CHIR 98014 不会影响从瘦弱动物分离的肌肉中胰岛素剂量反应。 CHIR 98014 作用于 db/db 鼠,ZDF 鼠,ob/ob 鼠,饮食引起的糖尿病 C57BL/6 鼠，及抗葡萄糖的 SHHF 鼠，降低高血糖，促进葡萄糖排出。此外, CHIR98014 作用于刚出生鼠的大脑皮层，降低 tau 蛋白 Ser396 位点的磷酸化水平。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3724	AZD1080
MB3738	AZD2858
MB4520	Bikinin
MB3730	BIO

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。CHIR-98014 是一种有效的，细胞通透的 GSK-3 抑制剂，可抑制 GSK-3α 和 GSK-3β 的活性。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体积 / 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0563 mL	10.2815 mL	20.5630 mL
5 mM	0.4113 mL	2.0563 mL	4.1126 mL
10 mM	0.2056 mL	1.0282 mL	2.0563 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验：	激酶实验: 96 孔板每孔加满 300 μL 含激酶，肽底物，和激活剂的 buffer(50 mM tris HCl,10 mM MgCl2,1 mM EGTA,1 mM 二硫苏糖醇,25 mM β-甘油磷酸,1 mM NaF,0.01% BSA,pH 7.5)。CHIR 98014 加到 3.5 μL DMSO 中, 随后 50 μL ATP 加到无细胞实验中，ATP 终浓度为 1 μM。温育后, 100 μL 重复三份转移到 Combiplate 八孔板上，每孔含 100 μL 50 μM ATP 和 20 mM EDTA。1 小时后，用 PBS 冲洗 5 次, 用 200 μL 闪烁液密封，30 分钟后，用闪烁计数器计数。所有实验步骤在室温下进行。
细胞实验：	**Cell lines:** CHO-IR 细胞 **Concentrations:** 0.01-10 μM **Incubation Time:** 30 分钟 **Method:** 表达人类胰岛素受体的 CHO-IR 细胞在含有 10%FBS 不含次黄嘌呤的 Hamm’s F12 培养基上生长。胰蛋白酶化的细胞按每孔 1×106 个细胞接种在含 2 mL 无 FBS 的培养基的 6 孔板上。24 小时后,更换培养基为 1 mL 含 GSK-3 抑制剂 CHIR 98014 的无血清培养基，对照组终 DMSO 浓度为 0.1%，在 37oC 下进行 30 分钟。细胞溶解在 50 mM tris(pH 7.8)中,tris 含 1 mM EDTA,1 mM DTT,100 mM NaF,1 mM 苯甲基磺酰氟(PMSF), 及 25 μg/mL 亮抑酶肽(buffer A)，然后在 4oC 下按 14000 g 转速离心 15 分钟。在有 6-磷酸葡萄糖存在下计算 GS 比活。
动物实验：	**Animal Models:** 8-9 周大的 db/db 鼠 **Formulation:** 溶于 15% Captisol，对照组溶于柠檬酸盐 **Dosages:** 30 mg/kg **Administration:** 皮下注射

【注意】

●我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。

●部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 **产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。 如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度<0.3%,以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度<5%,以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。