

## CHIR-99021 (CT99021) ; CHIR-99021

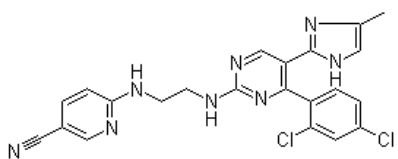
产品编号 : MB5682

质量标准 : >99%,GSK-3 $\alpha$ / $\beta$  抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C22H18Cl2N8	结 构 式	
分子量	465.34		
CAS No.	252917-06-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 10 mg/mL warmed (21.48 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-99021 是 GSK-3 $\alpha$ / $\beta$  抑制剂。

**别名 :** 3-Pyridinecarbonitrile, 6-[[2-[[4-(2,4-dichlorophenyl)-5-(5-methyl-1H-imidazol-2-yl)-2-pyrimidinyl]amino]ethyl]amino]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至黄色固体

溶解性 : .....DMSO 10 mg/mL warmed (21.48 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....>99%

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	CHIR-99021 (CT99021)是一种 GSK-3 $\alpha$ 和 GSK-3 $\beta$ 抑制剂, IC50 分别为 10 nM and 6.7 nM。	
<b>靶点</b>	GSK-3 $\beta$	GSK-3 $\alpha$
<b>IC50</b>	6.7 nM	10 nM
<b>体外研究</b>	与其最接近的同源物 CDC2 和 ERK2 以及其他蛋白激酶相比, CHIR-99021 对 GSK-3 的选择性大于 500 倍。此外, CHIR-99021 仅显示与一组 22 种药理学相关受体的弱结合, 对一组	

	23 种非激酶的抑制活性很小。CHIR-99021 诱导表达胰岛素受体的 CHO-IR 细胞中糖原合酶 (GS) 的活化, EC50 为 0.763 $\mu$ M。
<b>体内研究</b>	口服施用 30mg / kg 的 CHIR-99021 可增强 2 型糖尿病啮齿动物模型中的葡萄糖代谢, 给药后 3-4 小时血浆葡萄糖最大降低近 150mg / dl, 而血浆胰岛素保持在对照或低于对照水平。在 ZDF 大鼠口服葡萄糖激发前 1 小时口服施用 16 或 48 mg / kg 的 CHIR-99021 可显着改善葡萄糖耐量, 分别在 16 mg / kg 和 48 mg / kg 时血浆葡萄糖降低 14% 和 33%, 较高剂量的 CHIR-99021 还可在口服葡萄糖激发前降低高血糖症。

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)

MB3706	Tideglusib
MB3653	TWS119
MB5683	水溶性 CHIR-99021

**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-99021 (CT99021) 是一种 GSK-3 $\alpha$  和 GSK-3 $\beta$  抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1490 mL	10.7448 mL	21.4897 mL
5 mM	0.4298 mL	2.1490 mL	4.2979 mL
10 mM	0.2149 mL	1.0745 mL	2.1490 mL
50 mM	-	-	-

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> Insulin receptor-expressing CHO-IR cells; Primary rat hepatocytes</p> <p><b>Concentrations:</b> 0.01-10 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 30 min</p> <p><b>Method:</b></p> <p>表达人胰岛素受体的 CHO-IR 细胞在含有 10% 胎牛血清且无次黄嘌呤的 Hamm's F12 培养基中生长至 80% 汇合。将胰蛋白酶消化的细胞以 <math>1 \times 10^6</math> 个细胞/孔接种在 6 孔板中, 在 2ml 不含胎牛血清的培养基中。24 小时后, 将培养基替换为 1ml 含有 GSK-3 抑制剂或对照 (最终 DMSO 浓度 &lt; 0.1%) 的无血清培养基, 在 37<math>^{\circ}</math>C 下保持 30 分钟。裂解细胞并在 4<math>^{\circ}</math>C / 14000g 下离心 15 分钟。使用 Thomas 等人的滤纸试验, GS 的活性比率计算为不存在葡萄糖-6-磷酸</p>
-------------	---

	时的 GS 活性除以 5mmol / l 葡萄糖-6-磷酸存在下的活性。
<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> Female db/db mice; Male ZDF rats <b>Formulation:</b> HCl salts formulated <b>Dosages:</b> 8-48 mg/kg <b>Administration:</b> oral administration

**【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，否则会严重影响化合物活性，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。