

# CHIR-99021 (CT99021); CHIR-99021

产品编号: MB5682

质量标准:>99%,GSK-3α/β 抑制剂

包装规格:5MG

产品形式: solid

## 基本信息

分子式	C22H18Cl2N8		
分子量	465.34		
CAS No.	252917-06-9	结	N N
储存条件	-20℃,避光防潮密闭干燥	构	T N N N N N N N N N N N N N N N N N N N
\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	DMSO 10 mg/mL warmed (21.48 mM)	式	N H CI CI
溶解性	Water Insoluble		, ,
(25°C)	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-3α/β 抑制剂。

别名:3-Pyridinecarbonitrile, 6-[[2-[[4-(2,4-dichlorophenyl)-5-(5-methyl-1H-imidazol-2-yl)-2-pyrimidinyl]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℃,避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	CHIR-99021 (CT99021)是一种 GSK-3α 和 GS nM。	
靶点	GSK-3β	GSK-3α
IC50	6.7 nM	10 nM
1771-0170	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 0.763µM。
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 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)

Cell lines: Insulin receptor-expressing CHO-IR cells; Primary rat hepatocytes

Concentrations: 0.01-10 µM Incubation Time: 30 min

Method:

细胞实验

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  $1\times10$  6 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 <0.1%)的无血清培养基,在 37%下保持 30 分钟。 裂解细胞并在 4%/ 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







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

<del>标示</del> 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。

s240602



本产品仅供科研使用