

## SB 415286

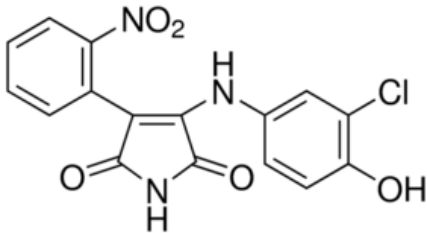
### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
	52973ES08	5 mg
SB 415286	52973ES10	10 mg
	52973ES50	50 mg

### 产品描述

SB 415286 (SB415286, SB-415286)是一种强效的、细胞渗透性的糖原合酶激酶-3 (GSK-3 $\alpha$ ) 抑制剂,其 IC<sub>50</sub> 值为 77.5 nM, K<sub>i</sub> 值为 30.75 nM, 也可抑制 GSK-3 $\beta$ , 抑制效果和 GSK-3 $\alpha$  相同, 是 GSK-3 有效选择性抑制剂。研究表明, SB 415286 在人肝细胞中可促进合成糖原, 在小鼠中枢神经中起保护作用并修复受损神经元。在原代神经元中, SB 415286 可以阻止 PI3K 途径诱导的细胞死亡。SB 415286 抑制 GSK3 $\beta$  的活性, 抑制雷帕霉素(rapamycin)介导的细胞周期蛋白 D1 下调和细胞周期停滞。同时, SB 415286 损伤 p53 依赖性的 p21 和 Puma 的转录激活, 促使 p53 介导的损伤应答从细胞周期停滞转变为细胞凋亡。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	3-[(3-Chloro-4-hydroxyphenyl)-amino]-4-(2-nitrophenyl)-1H-pyrrol-2,5-dione;	SB415286; SB-415286
中文名称 (Chinese Name)	3-[(3-氯-4-羟苯基)氨基]-4-(2-硝苯基)-1H-吡咯-2,5-二酮	
靶点 (Target)	GSK-3 $\alpha$ ; GSK-3 $\beta$	
CAS 号 (CAS NO.)	264218-23-7	
分子式 (Formula)	C <sub>16</sub> H <sub>10</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>5</sub>	
分子量 (Molecular Weight)	359.72	
外观 (Appearance)	固体粉末	
纯度 (Purity)	≥98%	
溶解性 (Solubility)	可溶于 DMSO: ≥10 mg/mL, 溶于乙醇, 不溶于水	
结构式 (Structure)		

### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。建议分装后-20°C避光保存, 避免反复冻融。

### 注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

## 使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

## 使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

### （一）细胞实验（体外实验）

为了检测 SB415286 对细胞活性的作用，接种  $4 \times 10^5$  个数量的白血病细胞系 K562 细胞至培养板中，培养 24 h。之后添加不同浓度（0, 5, 10, 20, 30, 40  $\mu\text{g}/\text{mL}$ ）SB415286 工作液，并孵育细胞 0-72 h。MTT 实验可以看出：SB415286 以剂量和时间依赖性的方式有效抑制细胞增殖。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

SB415286（0.1, 0.33, 1.0 mg/kg，皮下注射，每天两次）给药雌性 Wistar 大鼠，可有效降低大鼠体内三硝基苯甲酸(TNBS)诱发的急性结肠炎，并减少体重的下降，主要涉及 NF- $\kappa$ B 活性的下调，以及炎症介质的产生。<sup>[2]</sup> SB415286 以 1 mg/kg 的剂量给药显著抑制裸鼠体内 Neuro-2A 细胞的生长。<sup>[3]</sup>

## 参考文献

- [1]. Mirlashari MR, et al. Glycogen synthase kinase-3 (GSK-3) inhibition induces apoptosis in leukemic cells through mitochondria-dependent pathway. *Leuk Res.* 2012 Apr;36(4):499-508.
- [2]. Whittle BJ, et al. Reduction of experimental colitis in the rat by inhibitors of glycogen synthase kinase-3beta. *Br J Pharmacol.* 2006 Mar;147(5):575-82.
- [3]. Dickey A, Schleicher S, et al. GSK-3 $\beta$  inhibition promotes cell death, apoptosis, and in vivo tumor growth delay in neuroblastoma Neuro-2A cell line. *J Neurooncol.* 2011 Aug;104(1):145-53.