

CHIR-98014

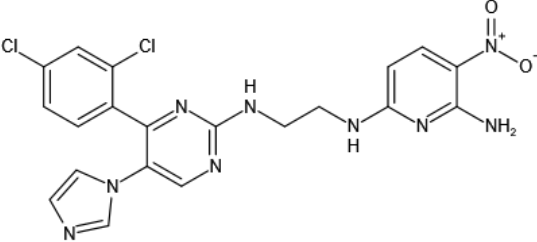
产品信息

产品名称	产品编号	规格
	52987ES08	5 mg
CHIR-98014	52987ES10	10 mg
	52987ES50	50 mg

产品描述

CHIR-98014 (又名 CT98014) 是一种有效的 GSK-3 抑制剂, 作用于 GSK-3 的高度同源 α 和 β 亚型具有相似效果, 无细胞试验中 IC50 为 0.65 nM/0.58 nM。此外, CHIR-98014 作为 ATP 竞争性抑制剂, 对 GSK-3 的选择性比其他 20 多种蛋白激酶, 包括 Cdc2、ERK2、Tie2、KDR 等, 的 500 倍至 > 10,000 倍。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	CHIR-98014; CHIR 98014; CT98014
中文名称 (Chinese Name)	N-6-[2-[[4-(2,4-二氯苯基)-5-(1H-咪唑-1-基)-2-嘧啶基]氨基]乙基]-3-硝基-2,6-吡啶二胺
靶点 (Target)	GSK-3 β ; GSK-3 α
CAS 号 (CAS NO.)	252935-94-7
分子式 (Formula)	C ₂₀ H ₁₇ C ₁₂ N ₉ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	486.31
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO (with gentle warming): ≥8 mg/mL, 不溶于乙醇和水
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 CHIR-98014 对 GSK3 的作用，用含递增浓度 CHIR-98014 的无血清培养基处理表达胰岛素受体的 CHO-IR 细胞或原代大鼠肝细胞 30 min，检测细胞糖原合成酶(GS)活性，结果发现，CHIR 98014 使 GS 活性比刺激高于基础，在 CHO-IR 细胞和原代大鼠肝细胞中，CHIR 98014 引起半数最大 GS 刺激的浓度(EC50)分别为 10^6 nM 和 10^7 nM。^[1] 研究表明，在小鼠 ES-D3 细胞中，用 1-10 μ M 的 CHIR-98014 处理 48 和 72 h 后，经 qPCR 和 Wnt-reporter assay 实验确认，通过抑制 GSK-3 显著激活 Wnt/ β -catenin 信号通路。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

为了检测 CHIR-98014 对 2 型糖尿病的作用，选用 ZDF 大鼠模型，口服 48 mg/kg CHIR 98014 治疗的 4 小时内，空腹高血糖显著降低，并在 oGTT (oral glucose tolerance test)期间葡萄糖水平得到改善。糖尿病和胰岛素抗性 db/db 小鼠在皮下给药 30 mg/kg CHIR 98014 治疗 4 小时也表现出空腹高血糖显著降低，并在 ipGTT (intraperitoneal glucose tolerance test)期间葡萄糖水平得到改善。^[1]

参考文献

- [1]. Ring, DB, et al., Selective glycogen synthase kinase 3 inhibitors potentiate insulin activation of glucose transport and utilization in vitro and in vivo. *Diabetes*, 2003. 52(3): p. 588-95.
- [2]. Naujok O, et al. Cytotoxicity and activation of the Wnt/beta-catenin pathway in mouse embryonic stem cells treated with four GSK3 inhibitors. *BMC Res Notes*. 2014. 7(1):273-281.