

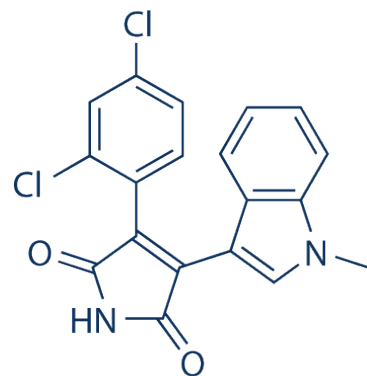
SB216763 (GSK-3抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0384-10mM	SB216763 (GSK-3 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0384-5mg	SB216763 (GSK-3 抑制剂)	5mg
SC0384-25mg	SB216763 (GSK-3 抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	3-(2,4-dichlorophenyl)-4-(1-methylindol-3-yl)pyrrole-2,5-dione
简称	SB216763
别名	SB-216763; SB216763; 3-(2,4-dichlorophenyl)-4-(1-methyl-1H-indol-3-yl)-1H-pyrrole-2,5-dione
中文名	—
化学式	C ₁₉ H ₁₂ N ₂ O ₂ Cl ₂
分子量	371.22
CAS号	280744-09-4
纯度	≥98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 23mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.35ml DMSO, 或者每3.71mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0384-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息

产品描述	SB216763是一种有效的, 选择性GSK-3 α 抑制剂, IC ₅₀ 为34.3nM; 对GSK-3 β 具有同样的抑制作用。				
信号通路	PI3K/Akt Signaling				
靶点	GSK-3 α	GSK-3 β	—	—	—
IC ₅₀	34.3nM	~34.3nM	—	—	—
体外研究	除了抑制GSK-3 α , SB 216763也同样有效作用于 GSK-3 β , 按10 μ M处理, 抑制达96%, 作用于24种其他蛋白激酶包括PKB α 和PDK1时具有最小活性, IC ₅₀ >10 μ M。SB-216763作用于人肝脏细胞, 刺激糖原合成, EC ₅₀ 为3.6 μ M, 且作用于HEK293细胞, 诱导 β -catenin-LEF/TCF相关报告基因的转录, 这种作用存在剂量依赖性, 按5 μ M处理, 诱导达到最大值, 增大2.5倍。与剂量依赖性显著抑制GSK-3 活性一致, SB 216763保护小脑颗粒神经元免受LY-294002或钾丧失而诱导的细胞凋亡, 这种作用具有浓度依赖性, 3 μ M时保护神经达到最高值, 与10mM LiCl作用效果形成对比。3 μ M SB 216763完全抑制 LY-294002诱导的鸡背神经节感觉神经元死亡。5 μ M SB 216763作用于HEK293细胞, 显著抑制小脑颗粒神经元中GSK-3依赖的神经元特异性微管相关蛋白的磷酸化, 且提高 β -catenin细胞质水平, 与Wnt调节的 GSK-3抑制效果差不多。25-50 μ M SB 216763作用于前列腺癌细胞系, 包括BXPc-3, MIA-PaCa2, PANC1, ASPC1, 和CFPAC, 降低细胞活力, 这种作用存在剂量依赖性, 且显著促进凋亡, 处理72小时, 凋亡达50%, 而对HMEC或WI38细胞系没有作用效果。				
体内研究	SB 216763按20mg/kg剂量处理患Bleomycin (BLM)诱导肺部炎症和纤维化的小鼠, 通过显著抑制炎症细胞因子MCP-1和TNF- α 的产量, 显著抑制肺部炎症和纤维化, 且显著提高BLM处理小鼠的寿命。SB 216763处理, 通过抑制肺泡上皮细胞损伤, 而显著降低BLM诱导的肺泡。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	在不同浓度SB 216763存在时, 在含1nM人GSK-3 α , 50mM MOPS pH 7.0, 0.2mM EDTA, 10mM Mg(Ac) ₂ , 7.5mM β -巯基乙醇, 5%(w/v)甘油, 0.01%(w/v) Tween-20, 10% (v/v) DMSO, 及28 μ M GS-2肽底物的反应

	混合物中，测量GSK-3激酶活性。GS-2肽序列对应GSK-3使糖原合酶磷酸的地区。加入0.34 μ Ci [33 P] γ -ATP开始实验。全部ATP浓度为10 μ M。实验在室温下进行30分钟后，加入含21mM ATP的1/3实验体积为2.5%(v/v) H ₃ PO ₄ ，终止反应。样本在P30磷酸纤维垫上展开，然后在0.5%(v/v) H ₃ PO ₄ 中冲洗6次。过滤垫密封到Wallac betaplate闪烁液的样品袋中。在Wallac microbeta闪烁计数器中计算测定 ³³ P渗透到底物肽中的量。
--	--

细胞实验	
细胞系	BXPC-3, MIA-PaCa2, PANC1, ASPC1, CFPAC
浓度	溶于DMSO，终浓度为~50 μ M
处理时间	24, 48和72小时
方法	使用不同浓度SB 216763处理细胞24, 48和72小时。通过MTS检测测量相对细胞活力。使用 Hoechst染色而测定凋亡细胞。

动物实验	
动物模型	患Bleomycin(BLM)诱导的肺部炎症和纤维化的C57BL/6N小鼠
配制	溶于DMSO，在盐水中稀释
剂量	20mg/kg
给药方式	静脉注射

➤ 参考文献

1. Coghlan MP, et al. Chem Biol, 2000, 7(10), 793-803.
2. Cross DA, et al. J Neurochem, 2001, 77(1), 94-102.
3. Ougolkov AV, et al. Cancer Res, 2005, 65(6), 2076-2081.
4. Gurrieri C, et al. J Pharmacol Exp Ther, 2010, 332(3), 785-794.

包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SC0384-10mM	SB216763 (GSK-3抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0384-5mg	SB216763 (GSK-3抑制剂)	5mg
SC0384-25mg	SB216763 (GSK-3抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件：

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月内有效。

注意事项：

- 本产品可能对人体有一定的毒害作用，请注意适当防护，以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明：

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降于管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：
<https://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2019.06.04