



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **9-ING-41**
CAS 号: **1034895-42-5**
产品货号: **S89072**

生物活性:

Description	9-ING-41 (Elarglusib) 是一种基于马来酰亚胺的 ATP 竞争性和选择性的糖原合酶激酶-3 β (GSK-3 β) 抑制剂, IC50 为 0.71 μ M。9-ING-41 显著导致癌细胞的细胞周期停滞, 自噬和凋亡。9-ING-41 具有抗癌活性, 并具有增强化疗活性分子抗肿瘤作用的潜力。			
IC50 & Target	GSK-3 β 0.71 μ M (IC50)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	BXPC-3	IC ₅₀	1 μ M	Growth inhibition of human BxPC3 cells after 72 hrs by MTS assay
	HuP-T3	IC ₅₀	0.6 μ M	Growth inhibition of human HUPT3 cells after 72 hrs by MTS assay
	MIA PaCa-2	IC ₅₀	5 μ M	Growth inhibition of human MIAPaCa2 cells after 72 hrs by MTS assay
In Vitro	9-ING-41 (化合物 26; 5 μ M; 持续 6、12、24、36 小时) 会导致 NF κ B 介导的 XIAP (最有效的抗凋亡蛋白) 表达显著降低, 从而导致 BXPC3 胰腺癌细胞随后发生凋亡[1]。			
	9-ING-41 (2、4 μ M; 48 小时) 降低神经母细胞瘤细胞活力, 诱导细胞凋亡[2]。			
	9-ING-41 (1、2 μ M; 24 小时) 是一种有效的淋巴瘤细胞细胞周期阻断剂[2]。			
	9-ING-41 (10 μ M; 持续 72 小时) 可增加自噬标记物 LC3 的表达[3]。			
	9-ING-41 (0.5、1.0、1.5、2.0 μ M) 浓度低至 1.0 mM 即可抑制所有 TCL 和 MCL 细胞系的增殖率[2]。			
	9-ING-41 (10 μ M; 持续 72 小时) 会在 24 小时后导致 G2/M 细胞周期阻断。9-ING-41 治疗可诱导膀胱癌细胞凋亡细胞死亡[3]。			
	9-ING-41 (25 μ M; 持续 96 小时) 显著降低 Cdk1 和 Cyclin B1 蛋白的表达, 并导致抗凋亡分子 Bcl-2 和 XIAP 的表达降低[3] 。			
	9-ING-41 (0.1-1 μ M) 抑制 GSK-3, 导致 NF- κ B 靶标 XIAP 的表达降低, 并导致神经母细胞瘤细胞出现显著的细胞凋亡, 如细胞凋亡标记物 PARP 裂解所示[4]。			
	Cell Cycle Analysis[2]			
	Cell Line:		Lymphoma cells (Jeko, Mino, and OCI-Ly cell lines)	
	Concentration:		1, 2 μ M	
	Incubation Time:		24 hours	
	Result:		Led to cell cycle arrest in G2/M.	
	Cell Autophagy Assay[3]			
	Cell Line:		T24 cancer cells	
Concentration:		25 μ M		
Incubation Time:		24 hours		
Result:		Showed extensive vacuolation and formation of autophagosome like structures in the cytoplasm.		
		Showed an increased expression of LC3, an autophagy marker.		
Western Blot Analysis[4]				
Cell Line:		SK-N-DZ and SK-N-BE neuroblastoma cells		



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	Concentration: Incubation Time: Result:	0.1, 1 μM 48 hours Inhibited GSK-3 leading to a decreased expression of the NF-κB target XIAP.																
In Vivo	9-ING-41 (40 mg/kg/每隔一天; 持续 17 天) 在 MCL 小鼠模型中具有单药抗肿瘤活性[2]。 Animal Model: Dosage: Administration: Result: NSG (NOD.Cg-Prkdcscidll2rgtm1Wjl/SzJ) mice[2] 40 mg/kg Every other day; for 17 days Had single-agent antitumor activity in a mouse model of MCL.																	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (123.66 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) <table><tr><td rowspan="4"> Preparing Stock Solutions </td><td> Solvent Concentration Mass </td><td> 1 mg </td><td> 5 mg </td><td> 10 mg </td></tr><tr><td> 1 mM </td><td> 2.4731 mL </td><td> 12.3655 mL </td><td> 24.7310 mL </td></tr><tr><td> 5 mM </td><td> 0.4946 mL </td><td> 2.4731 mL </td><td> 4.9462 mL </td></tr><tr><td> 10 mM </td><td> 0.2473 mL </td><td> 1.2366 mL </td><td> 2.4731 mL </td></tr></table> *请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。 -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。	Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration Mass	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	2.4731 mL	12.3655 mL	24.7310 mL	5 mM	0.4946 mL	2.4731 mL	4.9462 mL	10 mM	0.2473 mL	1.2366 mL	2.4731 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration Mass		1 mg	5 mg	10 mg													
	1 mM		2.4731 mL	12.3655 mL	24.7310 mL													
	5 mM		0.4946 mL	2.4731 mL	4.9462 mL													
	10 mM	0.2473 mL	1.2366 mL	2.4731 mL														
参考文献	[1]. Irina N Gaisina, et al. From a natural product lead to the identification of potent and selective benzofuran-3-yl-(indol-3-yl)maleimides as glycogen synthase kinase 3beta inhibitors that suppress proliferation and survival of pancreatic cancer cells. J Med Chem. 2009 Apr 9;52(7):1853-63. [2]. Wu X, et al. Targeting glycogen synthase kinase 3 for therapeutic benefit in lymphoma. Blood. 2019 Jul 25;134(4):363-373. [3]. Hiroo Kuroki, et al. 9-ING-41, a small molecule inhibitor of GSK-3beta, potentiates the effects of anticancer therapeutics in bladder cancer. Sci Rep. 2019 Dec 27;9(1):19977. [4]. Ugolkov AV, et al. 9-ING-41, a small-molecule glycogen synthase kinase-3 inhibitor, is active in neuroblastoma. Anticancer Drugs. 2018 Sep;29(8):717-724.																	
完整储备液配制表: 请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year。 -80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。																		
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg													
DMSO	1 mM	2.4731 mL	12.3655 mL	24.7310 mL	61.8276 mL													
	5 mM	0.4946 mL	2.4731 mL	4.9462 mL	12.3655 mL													
	10 mM	0.2473 mL	1.2366 mL	2.4731 mL	6.1828 mL													



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	15 mM	0.1649 mL	0.8244 mL	1.6487 mL	4.1218 mL
	20 mM	0.1237 mL	0.6183 mL	1.2366 mL	3.0914 mL
	25 mM	0.0989 mL	0.4946 mL	0.9892 mL	2.4731 mL
	30 mM	0.0824 mL	0.4122 mL	0.8244 mL	2.0609 mL
	40 mM	0.0618 mL	0.3091 mL	0.6183 mL	1.5457 mL
	50 mM	0.0495 mL	0.2473 mL	0.4946 mL	1.2366 mL
	60 mM	0.0412 mL	0.2061 mL	0.4122 mL	1.0305 mL
	80 mM	0.0309 mL	0.1546 mL	0.3091 mL	0.7728 mL
	100 mM	0.0247 mL	0.1237 mL	0.2473 mL	0.6183 mL



源叶