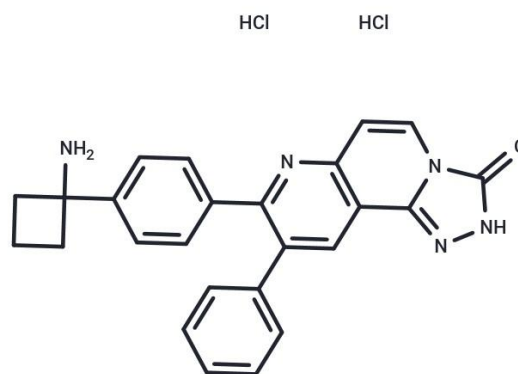


MK-2206 dihydrochloride(Akt 抑制剂)

货号: RPM0024

◆ 产品信息

中文名称/Chinese Name:	MK-2206 dihydrochloride(Akt 抑制剂)
别称/Synonyms:	MK-2206 2HCl
CAS 号/CAS NO.:	1032350-13-2
化学式/Formula:	$C_{25}H_{23}Cl_2N_5O$
分子量/M.Wt:	480.39
外观/Appearance:	固体
保存条件/Storage:	Powder: -20°C, 3 年 Insolvent: -80°C, 1 年



◆ 溶解信息

溶解度/Solubility:	Ethanol:	< 1 mg/mL (不溶或微溶)
	DMSO:	7.5 mg/mL (15.61 mM)
	10% DMSO +90% Saline:	0.75 mg/mL (1.56 mM), 现配现用

溶液配制参考/Preparing Stock Solutions:

	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0816 mL	10.4082 mL	20.8164 mL
5 mM	0.4163 mL	2.0816 mL	4.1633 mL
10 mM	0.2082 mL	1.0408 mL	2.0816 mL
50 mM	0.0416 mL	0.2082 mL	0.4163 mL

◆ 生物活性

产品描述/Description	MK-2206 dihydrochloride(Akt 抑制剂) 是一种变构 Akt 抑制剂, 抑制 Akt1、Akt2 和 Akt3 (IC ₅₀ =8/12/65 nM), 具有口服活性的、高效选择性。MK-2206 dihydrochloride 具有抗肿瘤活性。
靶点活性/Targets (EC ₅₀)	Akt3:65 nM (cell free), Akt1:8 nM (cell free), Akt2:12 nM (cell free)
体外活性/In vitro	人鼻咽癌细胞系 CNE-2、HONE-1 用 MK-2206 dihydrochloride (0.625-10 μM) 处理 24-48 h, 使用 Flow Cytometry 方法检测细胞周期情况。结果显示 MK-2206 dihydrochloride 导致 G0/G1 期细胞百分比的

	剂量依赖性增加和 S 期细胞数量的减少。MK-2206 dihydrochloride 诱导细胞周期停滞于 G1 期。 ^[1]
体内活性/In vivo	为检测体内抗肿瘤活性, 将 MK-2206 dihydrochloride (120 mg/kg in 30% captisol) 灌胃给药给携带人子宫内膜癌肿瘤的 NSG 小鼠, 每周两次, 持续三周。结果显示 MK-2206 dihydrochloride 治疗使 3 种不同类型和等级的 PDX 肿瘤的生长都受到显著抑制。 ^[2]
细胞实验/Cell Research	将 NPC 细胞系 CNE-1, CNE-2, HONE-1 和 SUNE-1 以每孔适当的密度接种到 96 孔板中。铺板 24 小时后, 向孔中加入不同浓度的 MK-2206 (0-10 μ M)。通过在给药后 72 或 96 小时使用细胞计数试剂盒测定细胞增殖。在酶联免疫吸附测定读数器上在 450nm 处测量光密度。 IC_{50} 值被确定为与未处理的对照细胞相比, 在暴露于药物 72 或 96 小时后导致 50% 细胞生长抑制的浓度。 ^[1]
动物实验/Animal Research	小鼠使用 4-6 周龄雄性 BALB / c 裸鼠。将 1×10^7 / mL 的 CNE-2 细胞悬浮于无血清培养基中, 并将 0.2mL 培养基皮下注射到每只裸鼠的右肋腹中。当平均肿瘤体积达到约 50mm ³ 时, 将小鼠随机分成三组。MK-2206 加入 30%Captisol。每组 MK-2206 (240mg / kg, 一周三次), MK-2206 (480mg / kg, 每周一次) 和 30%Captisol 稀释剂通过口服强饲法施 2 周。每隔一天用卡尺测量肿瘤生长, 并通过下式计算肿瘤体积。当对照组中的平均肿瘤体积大于 2,000mm ³ 时, 小鼠被杀死。将收获的肿瘤标本称重并固定在 10% 缓冲的福尔马林中并包埋在石蜡中。 ^[1]

◆ 参考文献

[1] Zhao YY, et al. Effects of an oral allosteric AKT inhibitor (MK-2206) on human nasopharyngeal cancer in vitro and in vivo. Drug Des Devel Ther. 2014 Oct 10;8:1827-37.

[2] Winder A, et al. The allosteric AKT inhibitor, MK2206, decreases tumor growth and invasion in patient derived xenografts of endometrial cancer. Cancer Biol Ther. 2017 Dec 2;18(12):958-964.

◆ 注意事项

1. 请在收到本产品后立即按照说明书中推荐的条件保存, 使用前进行离心, 使粉末充分沉降于管底。
2. 请根据实验目的及本产品的溶解性, 选择相应的溶剂配制成高浓度母液后使用, 最佳工作浓度请参考相关文献通过实验摸索优化, 本说明书中的数据来源于公开文献, 仅供参考。
3. 本产品仅供科研使用, 不可用于诊断或治疗领域。
4. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。