

MK2206 2HCl

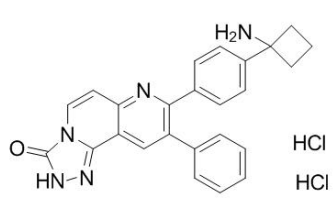
产品编号: MB3648

质量标准: >98%, 选择性的 Akt1/2/3 抑制剂

包装规格: 5MG;25MG;100MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C ₂₅ H ₂₁ N ₅ O ₂ ·2HCl	结构式	
分子量	480.39		
CAS No.	1032350-13-2		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 14 mg/mL (29.14 mM) Water Insoluble Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介: MK 2206 是一种口服有效的 Akt 变构抑制剂, 抑制 Akt1/Akt2/Akt3 的 IC₅₀ 分别为 5 nM/12 nM/65 nM。

别名: MK2206;MK-2206 dihydrochloride;

8-[4-(1-Aminocyclobutyl)phenyl]-9-phenyl-1,2,4-triazolo[3,4-f][1,6]naphthyridin-3(2H)-one dihydrochloride

物理性状及指标:

外观:黄色粉末

溶解性:DMSO: 14 mg/mL (29.14 mM);Water Insoluble;Ethanol Insoluble

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	MK-2206 2HCl 是一种高度选择性的 Akt1/2/3 抑制剂, 在无细胞试验中 IC ₅₀ 分别为 8 nM/12 nM/65 nM; 对 250 种其他蛋白激酶没有抑制活性。
特性	MK-2206 是第一个进入临床研究阶段的 Akt 小分子变构抑制剂。

靶点	Akt1 (Cell-free assay)	Akt2 (Cell-free assay)	Akt3 (Cell-free assay)
	8 nM	12 nM	65 nM
体外研究	MK-2206 是变构抑制剂, 由 pleckstrin 同源结构域激活。MK-2206 抑制 Akt 的苏氨酸 308 位点和丝氨酸 473 位点的自身磷酸化作用。另外, MK-2206 阻止 Akt 调节的下游信号分子(包括 TSC2, PRAS40, 及核糖体 S6 蛋白)的磷酸化作用。与抑制 Ras 突变型细胞系(如 NCI-H358, NCI-H23, NCI-H1299, 和 Calu-6)相比, MK-2206 更有效地抑制 Ras 野生型细胞系(如 A431, HCC827, 和 NCI-H292)。MK-2206 和细胞毒素药剂如 erlotinib 和 lapatinib 联用作用于肺部 NCI-H460 肿瘤细胞或者卵巢 A2780 肿瘤细胞, MK-2206 也显示出协同效应。		
体内研究	MK-2206 和这些细胞毒素药剂联用作用于 NCI-H292 移植瘤, MK-2206 显示出非常有效的抗癌活性。卵巢癌 A2780 移植瘤中, 按动物体重, 每千克处理 240mg MK-2206, 则可抑制 70% 以上的 Akt1/2 在苏氨酸 308 位点和丝氨酸 473 位点的磷酸化, 导致肿瘤生长抑制率达到 60%。		

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4288	Akt Inhibitor VIII, Isozyme-Selective,
MB4498	AT13148
MB3647	AZD5363
MB5663	Ipatasertib(GDC0068)

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。MK 2206 是一种口服有效的 Akt 变构抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体质量 浓度 积	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	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>Akt 激酶实验:</p> <p>通过得到的 GSK 生物素肽段基质测定 Akt 激酶。使用含镧系金属螯合物偶联单抗的均相时间分辨荧光(HTRF)测定肽段磷酸化程度, 这种单抗专门作用于与链霉亲和素——藻蓝素(SA-APC)载体相结合的磷酸化作用, SA-APC 载体可以结合到肽段的部分生物素上。当镧系金属螯合物与藻蓝素相接触时, 无辐射的能量从镧系金属螯合物传递给藻蓝素, 然后藻蓝素发射波值为 655 纳米的光线。工作液: 100X 蛋白酶抑制剂混合物(PIC): 1mg/ml 苯甲脒, 0.5 mg/ml 抑肽酶, 0.5 mg/ml 亮抑肽酶, 0.5 mg/ml 抑肽酶。10X 实验 buffer: 500 mM HEPES (pH 为 7.5), 1% PEG,</p>
------	--

	<p>16.6 mM EDTA, 1 mM EGTA, 1% BSA, 20 mM 9-甘油磷酸。抑制 buffer: 50 mM HEPES (pH 为 7.3), 16.6 mM EDTA, 0.1% BSA, 0.1% Triton X-100, 0.17 nM 标记的单抗, 0.0067mg/ml SA-APC。ATP/MgCl₂ 工作液: 1X 实验 buffer, 1 mM DTT, 1X PIC, 5% 甘油, 激活的 Akt。肽段工作液: 1X 实验 buffer, 1 mM DTT, 1X PIC, 5% 甘油 2 TM GSK 生物素肽段。工作液加到合适的孔中, 然后加入总负荷为 16 的 ATP/MgCl₂, 反应开始。含 MK-2206 的实验组和对照组加入总负荷为 10 的肽段工作液。然后加入总负荷为 13 的酶液, 混匀。反应进行 50 分钟, 然后加入总负荷为 60 的均相时间分辨荧光抑制 buffer 停止反应。阻断的反应在室温下温育 30 分钟以上, 然后使用仪器读数。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: A431, HCC827, NCI-H292, NCI-H358, NCI-H23, NCI-H1299, Calu-6, 和 NCI-H460 细胞</p> <p>Concentrations: 0, 0.3, 1, 和 3 μM</p> <p>Incubation Time: 72 或 96 小时</p> <p>Method:</p> <p>MK-2206 溶解在 DMSO 中, 在实验使用前用培养基稀释。细胞按 $2\sim 3\times 10^3$ 密度接种在 96 孔板上, 温育 24 小时。MK-2206 (分为 0, 0.3, 1, 和 3 μmol 四组) 处理细胞, 72 或者 96 小时后, 测定细胞增殖情况。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 SK-OV-3, NCI-H292, HCC70, PC-3, 和 NCI-H460 模型的雄性 CD1 裸鼠</p> <p>Formulation: 30% Captisol</p> <p>Dosages: 120 mg/kg</p> <p>Administration: 口服处理</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装: 您收到货物后最好不要自己进行分包, 因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质; 如您有特殊包装要求, 请在订购时候与我们客服代表阐明, 当然价格会做适当调整。对于开盖后, 长期未使用的, 请务必重新密封好, 建议 Parafilm 封口膜, 并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长, 超过产品有效期, 建议您重新购买, 以免影响实验质量。

2 储备液制备: 大部分试剂的溶液形式稳定性较差, 请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液, 请选用合适溶剂, 细胞培养类多选择 DMSO, 储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存, 一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前, 再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备: 请根据个人需要正确计算浓度, 稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的, 所以使用水性溶剂 (如 PBS) 稀释时, 可能会析出沉淀, 可通过超声使固体重新溶解, 不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂, 请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%, 以避免细胞毒性。

灭菌方式, 我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌, 请勿采用紫外, 射线或者高温灭菌方式, 否则会严重影响化合物活性, 甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用: 由于很多化合物是脂溶性的, 动物实验工作液配制失活, 可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂, 如吐温, CMC-NA, 甘油等, 具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO, 请确

保 DMSO 的终浓度<5%,以避免毒性作用。给药剂量设计时候,可以参考下表
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后,请及时查验产品的包装完整性,并对数量进行确认。对于很多微量的产品,数量低于 500MG 的,我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置,从而导致产品附着在管壁或者盖子上,这时候请不要先打开盖子,需正位放置轻轻拍打,使产品沉降到管底。对于液体产品,可以在 200 转左右稍作离心,管底收集液体,从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差,在下面范围内均属于我司正常范围,望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的,如果您购买的产品的量非常小,同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层,可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂(参照操作手册)并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量,我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物;对于具有吸湿性的化合物,暴露在空气中会吸收水分,呈现液滴状,这种产品需要放置在干燥器中保存。