

MRTX-1719

产品编号: MC8013

质量标准: >98%, BR

包装规格: 1mg / 5mg / 10mg

产品形式: 固体

基本信息:

分子式	C ₂₃ H ₁₈ ClFN ₆ O ₂	结 构 式	
分子量	464.88		
CAS No.	2630904-45-7		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
运输条件	湿冰运输 (按季节)		

简介: MRTX-1719 是一种有效的, 具有口服活性, 选择性的 PRMT5•MTA 复合物抑制剂, 对 PRMT5•MTA 和 PRMT5 的 IC₅₀ 分别为 3.6 和 20.5nM。MRTX-1719 可以与 PRMT5•MTA 复合物结合, KD 值为 0.14pM。

物理性状及指标:

外观:白色至淡黄色固体

溶解性:DMSO: 50mg/mL

有机溶剂残留:符合 ICH 及中国药典规定

纯度:>98%

用途及描述: 科研试剂, 仅限应用于分子生物学、药理学等科研方面, 严禁用于人体。MRTX-1719 在体内外显示出抗肿瘤活性, 可用于癌症研究。

生物活性:

靶点	PRMT5
体外研究	MRTX-1719 (10 天) 在 MTAP 缺失的 HCT116 细胞而非野生型细胞中抑制 PRMT5 活性, IC ₅₀ 为 8nM ^[1] 。 MRTX1719 (10 天)在 MTAP 敲除的 HCT116 细胞中的 IC ₅₀ 值为 12nM, 对野生型 HCT116 细胞的 IC ₅₀ 值为 890nM ^[1] 。

溶液配制:

制备储备液	溶剂体积 / 质量		1mg	5mg	10mg
	浓度				
	1mM		2.1511 mL	10.7555 mL	21.5109 mL
	5mM		0.4302 mL	2.1511 mL	4.3022 mL
	10mM		0.2151 mL	1.0755 mL	2.1511 mL

使用方法: (仅供参考)

细胞试验	Cell lines: HCT116 和 LU99 细胞 Concentrations: 0.1~10000nM Incubation Time: 4 天
------	-------------------------------------------------------------------------------------



	<p>Method: 研究 MRTX1719 降低 MTAP del 肿瘤细胞活力的选择性, 在 5 天的 CellTiter-Glo (CTG) 活力测定中对 70 个 MTAP del 和 26 个 MTAP WT 人类癌细胞系进行了评估。</p>
动物实验	<p>Animal Models: Lu-99 (MTAP/ cdkn2a 缺失的人肺癌细胞株)异种移植瘤模型</p> <p>Formulation: 溶于 DMSO, 在盐水中稀释</p> <p>Dosages: 12.5, 25, 50,100 mg/kg, 21 天</p> <p>Administration: 口服灌胃</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 (如 0.22 μ m 滤膜过滤), 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 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。
- 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。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 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。

参考文献

- [1]. Lars D Engstrom, et al. MRTX1719 is an MTA-cooperative PRMT5 inhibitor that exhibits synthetic lethality in preclinical models and patients with MTAP deleted cancer. *Cancer Discov.* 2023 Aug 8;CD-23-0669.
- [2]. Christopher R Smith, et al. Fragment-Based Discovery of MRTX1719, a Synthetic Lethal Inhibitor of the PRMT5•MTA Complex for the Treatment of MTAP-Deleted Cancers. *J Med Chem.* 2022 Feb 10;65(3):1749-1766.

S241001

