

HB230119

## MK-2206 2HCl

### 产品信息

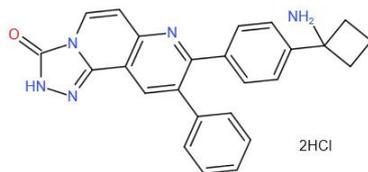
产品名称	产品编号	规格
MK-2206 2HCl	53008ES08	5 mg
	53008ES10	10 mg

### 产品描述

MK-2206 2HCl 是一种可口服的、特异选择性的 Akt 抑制剂，在无细胞试验中 MK-2206 2HCl 对 Akt1/2/3 的 IC<sub>50</sub> 值分别是 8 nM/12 nM/65 nM；MK-2206 2HCl 是第一个进入临床研究阶段的 Akt 小分子变构抑制剂。MK-2206 2HCl 在肿瘤细胞中可诱导细胞凋亡和细胞自噬。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	MK-2206;MK-2206 Dihydrochloride
中文名称 (Chinese Name)	8-[4-(1-氨基环丁基)苯基]-9-苯基-1,2,4-三唑并[3,4-F][1,6]嘧啶-3(2H)-酮二盐酸盐
靶点 (Target)	Akt1;Akt1;Akt3
通路 (Pathway)	PI3K/Akt/mTOR--Akt
CAS 号 (CAS NO.)	1032350-13-2
分子式 (Formula)	C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> N <sub>5</sub> O·2HCl
分子量 (Molecular Weight)	480.39
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO
结构式 (Structure)	



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃，有效期3年。建议分装后-20℃干燥保存，避免反复冻融。

### 注意事项

- 1) 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。

### 使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

### 使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

### （一）细胞实验（体外实验）

细胞按照  $2\sim 3\times 10^3$  密度接种于 96 孔板中孵育 24 h 后，培养基配置的 MK-2206 (0, 0.3  $\mu\text{M}$ , 1  $\mu\text{M}$ , 3  $\mu\text{M}$ ) 处理 96 孔中的细胞，72 h 或 96 h 后测定细胞增殖情况，MK-2206 增强拉帕替尼诱导的细胞凋亡。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

MK-2206 (120 mg/kg) 和厄洛替尼 (50 mg/kg) 口服处理 NCI-H292 肿瘤移植小鼠模型，14 h 后检测其药效学和抗肿瘤作用，Western blot 分析发现，MK-2206 中度 ( $53.1\pm 6.2\%$ ) 抑制 phospho-Akt 通路，轻度 ( $27.7\pm 5.9\%$ ) 抑制 phospho-Erk 通路，MK-2206 和厄洛替尼联合使用增强了对这两种通路的抑制作用。<sup>[1]</sup>

### 参考文献

- [1]. Hirai H, et al. MK-2206, an allosteric Akt inhibitor, enhances antitumor efficacy by standard chemotherapeutic agents or molecular targeted drugs in vitro and in vivo. *Mol Cancer Ther.* 2010 Jul;9(7):1956-67.
- [2]. Cheng Y, et al. eEF-2 kinase dictates cross-talk between autophagy and apoptosis induced by Akt Inhibition, thereby modulating cytotoxicity of novel Akt inhibitor MK-2206. *Cancer Res.* 2011 Apr 1;71(7):2654-63.
- [3]. Cui H, et al. The AKT inhibitor MK2206 suppresses airway inflammation and the pro-remodeling pathway in a TDI-induced asthma mouse model. *Mol Med Rep.* 2020 Nov;22(5):3723-3734.