



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: **MKT 077**
CAS 号: **147366-41-4**
产品货号: **S88414**

生物活性:

Description	MKT-077 (FJ-776) 是一种高水溶性线粒体染料, 具有显著的抗肿瘤活性。MKT-077 的细胞毒性低, 对广谱人癌细胞系 (结肠癌、乳腺癌、胰腺癌) 有抑制活性。MKT-077 可抑制裸鼠异植肿瘤模型的肿瘤生长。其荧光波长: Ex/Em=488/543 nm。			
IC50 & Target[1]	HSP70			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	CX-1	IC ₅₀	0.81 μM	In vitro inhibition of growth of human carcinoma CX-1 cell line (clonogenic assay).
	Cancer cell lines	IC ₅₀	1 μM	Antiproliferative activity against human bladder cancer cells
	Cancer cell lines	IC ₅₀	1 μM	Antiproliferative activity against human breast cancer cells
	Cancer cell lines	IC ₅₀	1 μM	Antiproliferative activity against human colon cancer cells
	FM3A	EC ₅₀	1.5 x 10 ⁻⁵ M	Cytotoxicity against mouse mammary tumor FM3A cells representing a model of host
	KB	IC ₅₀	> 69 μM	In vitro inhibition of growth of KB cells (cytotoxic assay).
	L6	IC ₅₀	114.8 μM	Cytotoxicity against rat L6 cells after 72 hrs by Alamar blue assay
	MCF7	EC ₅₀	2.2 μM	Cytotoxicity against human MCF7 cells assessed as growth inhibition after 72 hrs by MTT assay
	MDA-MB-231	EC ₅₀	1.4 μM	Cytotoxicity against human MDA-MB-231 cells assessed as growth inhibition after 72 hrs by MTT assay
	MEF	EC ₅₀	> 50 μM	Cytotoxicity against C57BL/6 mouse MEF assessed as growth inhibition after 72 hrs by MTT assay
	NCI-H460	IC ₅₀	1.3 μM	Antitumor activity against human NCI-H460 cells
In Vitro	MKT-077 溶液的制备 1.1 储备液的制备 将 1 mg MKT-077 溶解于 0.2315 mL DMSO 中, 得到 10 mM 的 MKT-077。 注意: 建议储存储备液 -20℃、-80℃ 避光保存, 避免反复冻融。 1.2 MKT-077 工作液的制备 用无血清细胞培养基稀释储备液或 PBS 取 5-10 μM MKT-077 工作液。 注意: 请根据实际情况调整 MKT-077 工作液的浓度。 细胞染色 2.1 细胞制备。 悬浮细胞: 4℃, 1000 g 离心 3-5 分钟, 弃上清。PBS 洗涤 2 次, 每次 5 分钟。 贴壁细胞: 弃去细胞培养基, 加入胰蛋白酶解离细胞, 制成单细胞悬液。在 4℃ 下以 1000 g 离心 3-5 分钟, 然后弃去上清液。PBS 洗涤 2 次, 每次 5 分钟。			



	2.2 加入 1 mL MKT-077 工作液, 室温孵育 30 分钟。 2.3 4℃, 400 g 离心 3-4 分钟, 弃上清。 2.4 PBS 洗涤 2 次, 每次 5 分钟。 2.5 用无血清细胞培养基或 PBS 重悬细胞, 荧光显微镜或流式细胞仪检测。																	
In Vivo	在整个处理过程中, MKT-077 的全身给药显著延迟了小鼠 TT 异种植物的生长。在 MKT-077 处理结束时, 发现 MKT-077 处理组的肿瘤重量比对照组低约两倍。MKT-077 处理还会导致动物体重减轻和一般毒性[1]。结果表明, 从大鼠肝脏中分离出的线粒体中琥珀酸诱导的、ADP 刺激的呼吸速率每天按 1kg 体重推注 15 mg MKT-077 连续 5 天, 持续 5 天, 显著低于未处理的对照组[3]。																	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 56.67 mg/mL (131.18 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 Mass Concentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>2.3148 mL</td><td>11.5741 mL</td><td>23.1481 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.4630 mL</td><td>2.3148 mL</td><td>4.6296 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.2315 mL</td><td>1.1574 mL</td><td>2.3148 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℃, 6 months; -20℃, 1 month (sealed storage, away from moisture and light)。-80℃ 储存时, 请在 6 个月内使用, -20℃ 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 4.25 mg/mL (9.84 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 4.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 42.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 4.25 mg/mL (9.84 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 4.25 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 42.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	2.3148 mL	11.5741 mL	23.1481 mL	5 mM	0.4630 mL	2.3148 mL	4.6296 mL	10 mM	0.2315 mL	1.1574 mL	2.3148 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration		1 mg	5 mg	10 mg													
	1 mM		2.3148 mL	11.5741 mL	23.1481 mL													
	5 mM		0.4630 mL	2.3148 mL	4.6296 mL													
	10 mM	0.2315 mL	1.1574 mL	2.3148 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

参考文献

- [1]. Starenki D, et al. Selective Mitochondrial Uptake of MKT-077 Can Suppress Medullary Thyroid Carcinoma Cell Survival In Vitro and In Vivo. Endocrinol Metab (Seoul). 2015 Dec;30(4):593-603.
- [2]. Li X, et al. Analogs of the Allosteric Heat Shock Protein 70 (Hsp70) Inhibitor, MKT-077, as Anti-Cancer Agents. ACS Med Chem Lett. 2013 Nov 14;4(11)..
- [3]. Starenki D, et al. Selective Mitochondrial Uptake of MKT-077 Can Suppress Medullary Thyroid Carcinoma Cell Survival In Vitro and In Vivo. Endocrinol Metab (Seoul). 2015 Dec;30(4):593-603.
- [4]. Li X, et al. Analogs of the Allosteric Heat Shock Protein 70 (Hsp70) Inhibitor, MKT-077, as Anti-Cancer Agents. ACS Med Chem Lett. 2013 Nov 14;4(11).
- [5]. Weisberg EL, et al. In vivo administration of MKT-077 causes partial yet reversible impairment of mitochondrial function. Cancer Res. 1996 Feb 1;56(3):551-5.

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, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture and light)。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3148 mL	11.5741 mL	23.1481 mL	57.8704 mL
	5 mM	0.4630 mL	2.3148 mL	4.6296 mL	11.5741 mL
	10 mM	0.2315 mL	1.1574 mL	2.3148 mL	5.7870 mL
	15 mM	0.1543 mL	0.7716 mL	1.5432 mL	3.8580 mL
	20 mM	0.1157 mL	0.5787 mL	1.1574 mL	2.8935 mL
	25 mM	0.0926 mL	0.4630 mL	0.9259 mL	2.3148 mL
	30 mM	0.0772 mL	0.3858 mL	0.7716 mL	1.9290 mL
	40 mM	0.0579 mL	0.2894 mL	0.5787 mL	1.4468 mL
	50 mM	0.0463 mL	0.2315 mL	0.4630 mL	1.1574 mL
	60 mM	0.0386 mL	0.1929 mL	0.3858 mL	0.9645 mL
	80 mM	0.0289 mL	0.1447 mL	0.2894 mL	0.7234 mL
	100 mM	0.0231 mL	0.1157 mL	0.2315 mL	0.5787 mL