



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: **MRT 68921 dihydrochloride**

CAS 号: **2080306-21-2**

产品货号: **T23944**

生物活性:

生物活性:				
Description	MRT68921 dihydrochloride is a potent NUAK1/ULK1 dual inhibitor. MRT68921 dihydrochloride inhibits ULK1 and ULK2 with IC50 values of 2.9 nM and 1.1 nM, respectively. MRT68921 dihydrochloride can block cells autophagy and kill tumor cells by breaking the balance of oxidative stress signals. MRT68921 dihydrochloride can inhibit cell proliferation and induce ROS production and apoptosis. MRT68921 dihydrochloride can be used for the research of cancer, such as breast cancer[1][2].			
IC50 & Target	ULK2 1.1 nM (IC50)	ULK1 2.9 nM (IC50)	GSK-3β	Bcl-2
In Vitro	MRT68921 dihydrochloride (1 μM, 1 h) 可减少小鼠胚胎成纤维细胞 (MEFs) 中的基础 LC3 斑点并阻断基础自噬[1]。			
	MRT68921 dihydrochloride (1 μM) 可降低 TBK1 敲除及匹配的野生型 MEFs 中的 LC3-II 水平[1]。			
	MRT68921 dihydrochloride (24 h) 在癌细胞中表现出细胞毒性, 其 IC50 值范围为 1.76-8.91 μM[2]。			
	MRT68921 dihydrochloride (0-10 μM, 8-24 h) 可诱导 NCI-H460 和 MNK45 细胞中活性氧 (ROS) 的产生和凋亡[2]。			
	MRT68921 dihydrochloride (0-5 μM, 8h) 可抑制 U251 和 MNK45 细胞中的 NUAK1/MYPT1/Gsk3β 及自噬相关信号通路[2]。			
	Western Blot Analysis[1]			
	Cell Line:	U251 and MNK45 cells		
Concentration:	0, 0.5, 1, 2, 3 and 5 μM			
Incubation Time:	8 h			
Result:	Increased cleaved PARP1 expression. Downregulated phosphorylation of MYPT1 and Gsk3 尾. Increased puncta LC3.			
In Vivo	MRT68921 dihydrochloride (10-40 mg/kg, 皮下注射, 每日 1 次, 共 7 次) 在 NCI-H460 肿瘤小鼠模型中可抑制肿瘤生长[2]。			
	MRT68921 dihydrochloride (20 mg/kg, 皮下注射, 每两天 1 次, 共 7 次) 在 MNK45 肿瘤小鼠模型中可抑制肿瘤生长[2]。			
	MRT68921 dihydrochloride (20 mg/kg, 腹腔注射, 每日 1 次, 共 7 次) 可减少 4T1 肿瘤小鼠模型的肺转移结节数量[2]。			
	Animal Model:	NCI-H460 tumor mice models[2]		
	Dosage:	10, 20, or 40 mg/kg		
	Administration:	Subcutaneously injection, daily for 7 times		
	Result:	Reduced tumor volume. Increased Bax levels and decreased Bcl-2 levels.		
	Animal Model:	MNK45 tumor mice models[2]		
Dosage:	20 mg/kg			
Administration:	Subcutaneously injection, every 2 days for 7 times			
Result:	Reduced tumor volume.			



	Animal Model:	4T1 tumor mice models[2]			
	Dosage:	20 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneally injection, daily for 7 times			
	Result:	Reduced the number of lung metastatic nodules. Had no abnormal structures of the heart, kidney, liver, and spleen.			
Solvent&Solubility	细胞实验: H2O 中的溶解度 : 20.83 mg/mL (41.04 mM; 超声助溶 (<60° C)) DMSO 中的溶解度 : 8.33 mg/mL (16.41 mM; 超声助溶 (<60° C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.9704 mL	9.8522 mL	19.7044 mL
		5 mM	0.3941 mL	1.9704 mL	3.9409 mL
		10 mM	0.1970 mL	0.9852 mL	1.9704 mL
* 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, 1 year; -20°C, 6 months (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 个月内使用。					
参考文献	[1]. Petherick KJ, et al. Pharmacological inhibition of ULK1 kinase blocks mammalian target of rapamycin (mTOR)-dependent autophagy. J Biol Chem. 2015 May 1;290(18):11376-83.				
	[2]. Chen Y, et al. Dual targeting of NUAK1 and ULK1 using the multitargeted inhibitor MRT68921 exerts potent antitumor activities. Cell Death Dis. 2020 Sep 1;11(8):712.				
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, 1 year; -20°C, 6 months (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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 / H2O	1 mM	1.9704 mL	9.8522 mL	19.7044 mL	49.2611 mL
	5 mM	0.3941 mL	1.9704 mL	3.9409 mL	9.8522 mL
	10 mM	0.1970 mL	0.9852 mL	1.9704 mL	4.9261 mL
	15 mM	0.1314 mL	0.6568 mL	1.3136 mL	3.2841 mL
DMSO	20 mM	0.0985 mL	0.4926 mL	0.9852 mL	2.4631 mL
	25 mM	0.0788 mL	0.3941 mL	0.7882 mL	1.9704 mL
	30 mM	0.0657 mL	0.3284 mL	0.6568 mL	1.6420 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: shyysw@sina.com

	40 mM	0.0493 mL	0.2463 mL	0.4926 mL	1.2315 mL
--	-------	-----------	-----------	-----------	-----------

* 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶