

Lonafarnib (SCH-66336)

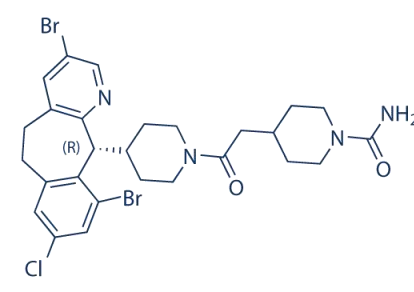
产品编号: MB3581

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C ₂₇ H ₃₁ Br ₂ ClN ₄ O ₂	结 构 式	
分子量	638.82		
CAS No.	193275-84-2		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H ₂ O : Insoluble		
	DMSO: 127 mg/mL (198.80 mM)		
	Ethanol: 127 mg/mL (198.80 mM)		
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: Lonafarnib 是一种口服生物有效的 FPTase 抑制剂, 作用于 H-ras, K-ras-4B 和 N-ras, 无细胞试验中 IC₅₀ 分别为 1.9 nM, 5.2 nM 和 2.8 nM。Phase 3。

中文名字: 洛那法尼

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H₂O : Insoluble; Ethanol: 127 mg/mL (198.80 mM); DMSO: 127 mg/mL (198.80 mM)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	Lonafarnib 是一种口服生物有效的 FPTase 抑制剂, 作用于 H-ras, K-ras-4B 和 N-ras, 无细胞试验中 IC ₅₀ 分别为 1.9 nM, 5.2 nM 和 2.8 nM。Phase 3。		
IC₅₀ & Target	H-ras (Cell-free assay)	N-ras (Cell-free assay)	K-ras-4B (Cell-free assay)
	1.9 nM	2.8 nM	5.2 nM
体外	SCH66336 在 0.1 μM 到 8 μM 浓度范围均可抑制头部和颈部鳞状细胞癌(HNSCC) 生长和诱导凋亡, 抑制效果具有剂量和时间依赖性。SCH66336 (8 μM)可在 SqCC/Y1 细胞中抑制蛋白激酶 B/Akt 活性和磷酸化 Akt 蛋白底物糖原合酶激酶 (GSK) - 3β, 转录因子和 BAD。SCH66336 对多细胞系有抗增殖作用, IC ₅₀ 范围从 0.6 μM 到 32.3 μM ; Lonafarnib 诱导		

	CCAAT /增强子结合蛋白同源蛋白 (CHOP) 依赖性 DR5 启动子的转录激活, 从而诱导 CHOP 依赖性的 DR5 上调。Lonafarnib (< 10 μM) 可激活 caspase - 8 及其下游的半胱氨酸蛋白酶, 从而诱导 H1792 细胞凋亡。Lonafarnib (5 μM)可增加 DR5 的细胞表面分布, 增强肿瘤坏死因子相关凋亡诱导配体诱导的 H1792 细胞凋亡。
细胞实验:	Cell lines: UMSCC10B, UMSCC14B, UMSCC17B, UMSCC22B, 和 UMSCC35, UMSCC38 细胞 Concentrations: 0.1 μM - 8 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 细胞铺板于 96 孔板中, 后续培养 5 天, 据此确定起始密度。24 小时后, 用不同浓度 SCH66336 处理细胞。SCH66336 溶解于 DMSO。对照组细胞用同样量的 DMSO 处理。5 天后用 SRB 法检测细胞数量。生长抑制的百分比的计算公式为: 增长抑制百分比= (1-At/Ac) ×100, At 和 Ac 分别代表实验组和对照组的吸收值。IC 50 值由剂量反应曲线确定。(Only for Reference)
动物实验:	Animal Models: 6-12 周龄 NOD/SCID 小鼠 Formulation: 20% (w/v) HPβCD Dosages: 50 mg/kg Administration: 口服 (Only for Reference)

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)

MB1149	Meclofenoxate HCl
MB4245	FTI 277 HCl
MB4304	FK866 (APO866)

储液配置及储存: 按表中溶解性配置; 如溶解困难, 可以通过快速搅拌, 超声或温和加热 (在 45-60°C 下水浴)。液体稳定性报道的很少, 建议现配现用, 如需储存, 建议: -20°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

浓度	DMSO 质量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.5654 mL	7.8269 mL	15.6539 mL
5 mM	0.3131 mL	1.5654 mL	3.1308 mL
10 mM	0.1565 mL	0.7827 mL	1.5654 mL
50 mM	0.0313 mL	0.1565 mL	0.3131 mL

【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。