

FTI277 HCl ; FTI 277 HCl

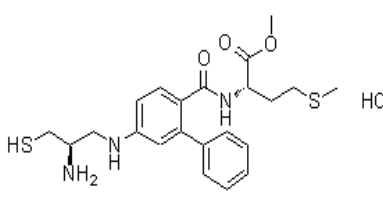
产品编号 : MB4245

质量标准 : >98%,(FTase)抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C22H29N3O3S2.HCl	结构式	
分子量	484.07		
CAS No.	180977-34-8		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 96 mg/mL (198.31 mM) Water : 17 mg/mL (35.11 mM) Ethanol : 14 mg/mL warmed (28.92 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 : FTI-277 盐酸盐是法尼基转移酶 FTase 抑制剂, 高效 Ras CAAX 肽模拟物, 可抑制 H-Ras 和 K-Ras 信号转导。

别名 : L-Methionine, N-[[5-[[[(2R)-2-amino-3-mercaptopropyl]amino][1,1'-biphenyl]-2-yl]carbonyl]-, methyl ester, monohydrochloride (9CI)

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 96 mg/mL (198.31 mM) ; Water : 17 mg/mL (35.11 mM) ; Ethanol : 14 mg/mL warmed (28.92 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	FTI 277 HCl 是 FTI 277 的甲酯, 是一种有效的选择性 farnesyltransferase (FTase)抑制剂, IC50 为 500 pM, 选择性比密切相关的 GGTase I 高 100 倍。
靶点	FTase (Cell-free assay)

	500 pM
体外研究	FTI-277 抑制 Ras 加工, IC50 为 100 nM, 但不抑制全细胞中四异戊二烯化 Rap1A 加工。FTI-277 诱导细胞质非法尼化 H-Ras 积累, 在细胞质中积累无活性的 Ras/Raf, 并阻断 H-RasF 细胞中组成型 MAPK 激活。FTI-277 引起辐射后细胞凋亡增加, 并增加 H-ras 转化的大鼠胚胎细胞的辐射敏感性。在耐药骨髓瘤细胞中, FTI-277 也会抑制细胞生长, 并诱导细胞凋亡。在 SH-SY5 细胞中, FTI-277 减少细胞退化, 活化, c-Jun-N 端激酶级联和 Ras 激活过程中甲基苯丙胺诱导的毒性作用。
体内研究	在感染乙型肝炎病毒(HBV) 和 HDV 的小鼠体内, FTI-277 (50 mg/kg/d i.p.)有效清除 HDV 病毒血症。

用途及描述: 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。本品是一种有效的选择性 farnesyltransferase (FTase)抑制剂, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.0658 mL	10.3291 mL
5 mM	0.4132 mL	2.0658 mL	4.1316 mL	
10 mM	0.2066 mL	1.0329 mL	2.0658 mL	
50 mM	0.0413 mL	0.2066 mL	0.4132 mL	

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>FTase 和 GGTase I 活性测定:</p> <p>测定 60,000×g 人 Burkitt 淋巴瘤(Daudi)细胞上清液中的 FTase 和 GGTase I 活性。抑制研究通过测定 Ras CAAX 模拟肽抑制 [³H]farnesyl 和 [³H]geranylgeranyl 分别从 [³H]farnesylpyrophosphate 与 [³H]geranylgeranylpyrophosphate 转移到 H-Ras-CVLS 与 H-Ras-CVLL 的能力进行。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: 8226, U266, 和 H929 多发性骨髓瘤细胞系</p> <p>Concentrations: ~10 μM</p> <p>Incubation Time: 96 小时</p> <p>Method: 细胞以 8000–14 000 细胞/孔接种于 96 孔板。建立 FTI-277 的剂量响应曲线, 细胞在 3.75 倍 10⁻⁷ M 到 1 倍 10⁻⁵ M 范围内两倍连续稀释的培养液中培养 96 小时。然后连续药物接触, 并加入 50 μL MTT 染料。不溶性甲瓞络合物用 DMSO 溶解, 吸光度在 540 nm 下测量。IC50s 和 95%置信区间通过剂量反应曲线线性部分的回归分析计算。</p>

动物实验	<p>Animal Models: HBV/HDV-转基因的 FVB 小鼠</p> <p>Formulation: 5% DMSO , 0.5 mM DTT 无菌生理盐水</p> <p>Dosages: 50 mg/kg/d</p> <p>Administration: i.p.</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，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，否则会严重影响化合物活性，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，如果您购买的产品的量非常小，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。