

GGTI 298 TFA salt; GGTI298 TFA salt

产品编号：MB6094

质量标准：>98%,BR

包装规格：1MG;5MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C27H33N3O3S.C2HF3O2	结构式
分子量	593.66	
CAS No.	1217457-86-7	
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥	
溶解性 (25°C)	DMSO: 100 mg/mL (168.44 mM)	
	Water Insoluble	
	Ethanol : 100 mg/mL (168.44 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：GGTI298 Trifluoroacetate 是有效的 **GGTase I** 抑制剂。

别名：(S)-methyl 2-(4-(((R)-2-amino-3-mercaptopropyl)amino)-2-(naphthalen-1-yl)benzamido)-4-methylpentanoate 2,2,2-trifluoroacetate

物理性状及指标：

外观：……………淡黄色至黄色固体

溶解性：…………DMSO: 100 mg/mL (168.44 mM); Water Insoluble; Ethanol : 100 mg/mL (168.44 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	GGTI 298 是牛儿基转移酶 I (geranylgeranyltransferase I) 抑制剂，能够将人类肿瘤细胞细胞周期阻止在 G1 期并诱导凋亡。
靶点	GGTase I
体外研究	GGTI-298 将人类肿瘤细胞的细胞周期阻滞在 G1 期，并诱导凋亡。对人类肺癌细胞 Calu-1 处理以 GGTI-298 抑制成视网膜细胞瘤蛋白的磷酸化，成视网膜细胞瘤蛋白的磷酸化是 G1 向 S 期转变的关键步骤。两个 G1/S 周期蛋白依赖性激酶 CDK2 和 CDK4，其活性在受到 GGTI-298 处理后被抑制 (Calu-1 细胞)。GGTI-298 对 CDK2、CDK4、CDK6 以及细胞周期蛋白 D1 和 E 的表达水平影响不大，但是会降低细胞周期蛋白 A 的水平。GGTI-298 提高抑制蛋白 p21 和 p15 的表达水平，而对 p27 和 p16 影响不大。GGTI-298 促进 p21、p27 与 CDK2 的结合，而减少它们与 CDK6 的结合。它还能促进 p15 与 CDK4 的结合，减少其与 p27 的结合。对纤维母细胞预处理 GGTI-298，将阻止 PDGF-和 EGF-依赖性的酪氨酸激酶受体的酪氨酸磷酸化。GGTI-298

	对纤维母细胞、上皮细胞、平滑肌细胞具有抗增殖作用，其可能是通过 G1 期阻滞而介导这种生长抑制作用。
体内研究	GGTI-298 在裸鼠中抑制肿瘤的生长。

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。GGTI 298 是牛儿基转移酶 I (geranylgeranyltransferase I) 抑制剂，能够将人类肿瘤细胞细胞周期阻止在 G1 期并诱导凋亡。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

浓度 \ 质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.6845 mL	8.4223 mL	16.8447 mL
5 mM	0.3369 mL	1.6845 mL	3.3689 mL
10 mM	0.1684 mL	0.8422 mL	1.6845 mL
50 mM	0.0337 mL	0.1684 mL	0.3369 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验	Cell lines: 人类肺癌细胞系 Calu-1
	Concentrations: 15 μ M
动物实验	Incubation Time: 48 h
	Method: 用 15 μ M 的 GGTI-298 处理细胞 48 小时，然后用 HEPES lysis buffer 对细胞进行裂解。然后将蛋白溶于 12.5% 或 7% 的 SDS-PAGE 胶中，使用相应抗体进行免疫印迹。
动物实验	Animal Models: 裸鼠
	Formulation: 于 DMSO 中储存，用生理盐水稀释至工作浓度
	Dosages: 1.16 mg/kg
	Administration: 皮下注射

【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物变质；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(M ²)	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。