

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	T71107
产品名称:	Tipifarnib

产品简介:

一种抑制法尼基转移酶 (FTase), IC ₅₀ 为 0.86 nM。Tipifarnib 具有潜在抗肿瘤和抗寄生虫活性。	
靶点:	IC ₅₀ : 0.86 nM (FTase)
体外研究:	
Tipifarnib 是一种有效的克氏锥虫 (Trypanosoma Cruzi) 抑制剂, ED ₅₀ 为 4 nM。	
Tipifarnib 抑制核纤层蛋白 B 肽和 K-RasB 肽的分离人法尼基转移酶, IC ₅₀ 分别为 0.86 nM 和 7.9 nM。	
Tipifarnib 在侵袭性前列腺癌 (PCa) 中抑制细胞生长或血管生成, 并诱导细胞凋亡。	
Tipifarnib (0.25 μM, 1 μM; 48 h) 显示 C4-2B 细胞和 PC-3 细胞外泌体浓度显著降低。	
Tipifarnib (1 μM) 显著抑制 C4-2B 细胞中 Alix、nSMase2 和 Rab27a 的蛋白浓度。	
Tipifarnib (0.25 μM) 显著抑制 p-ERK (Ras/Raf/ERK 信号通路的下游效应分子) 的激活, 但不抑制 C4-2B 和 PC-3 细胞中的总 ERK。	
Tipifarnib (1.25-5 μM; 30min) 促进 U937 细胞内质网应激, 导致细胞内钙稳态失调。	
体内研究:	
Tipifarnib (10 mg/kg; 腹腔注射; 单剂量) 上调肝脏抗凋亡蛋白 Bcl-xL, 防止 GalN/LPS 诱导小鼠死亡。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
Chloroform (Slightly), Methanol (Slightly)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	2.0433 mL	10.2167 mL	20.4334 mL
5 mM	0.4087 mL	2.0433 mL	4.0867 mL
10 mM	0.2043 mL	1.0217 mL	2.0433 mL
储备液的保存方式: -80° C, 1 year; -20° C, 6 months.			
二: 体内实验			
1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.11 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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。			
2、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.11 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。			



以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 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。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil

Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (5.11 mM); 澄清溶液

此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中，混合均匀。

4、请依序添加每种溶剂： 20% HP- β -CD/10 mM Citrate pH 2.0

Solubility: 10 mg/mL (20.43 mM); 澄清溶液; 超声助溶 ($<60^{\circ}$ C)

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

<1 mg/mL 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。

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。

三、动物实验

Animal Model:	GalN/LPS challenge mouse
Dosage:	10 mg/kg; while challenge with GalN (400 mg/kg; IP) and LPS (32 g/kg)
Administration:	IP; 60 min before challenge
Result:	Protected primary hepatocytes from GalN/tumor necrosis factor-induced cell death. Inhibited caspase 3 activation and upregulating antiapoptotic proteins.

注意事项:

- 1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: -20°C

