

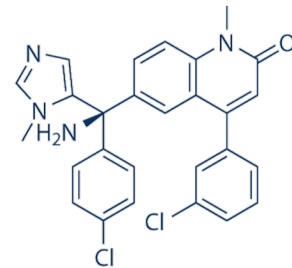
Tipifarnib (FTase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD7185-10mM	Tipifarnib (FTase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7185-5mg	Tipifarnib (FTase抑制剂)	5mg
SD7185-25mg	Tipifarnib (FTase抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	6-[(R)-amino-(4-chlorophenyl)-(3-methylimidazol-4-yl)methyl]-4-(3-chlorophenyl)-1-methylquinolin-2-one
简称	Tipifarnib
别名	IND 58359, R115777, R 115777, R-115777, Zarnestra
中文名	替吡法尼
化学式	C ₂₇ H ₂₂ Cl ₂ N ₄ O
分子量	489.4
CAS号	192185-72-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 14mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.02ml DMSO, 或每4.89mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD7185-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Tipifarnib是一种有效的, 特异性farnesyltransferase (FTase)抑制剂, 作用于H-ras或N-ras突变细胞, 具有最显著的抗增殖作用效果。Phase 3。				
信号通路	Metabolism				
靶点	Ftase	—	—	—	—
IC50	0.6nM	—	—	—	—
体外研究	与DMSO处理的LGL T细胞相比, 用5μM Tipifarnib处理72小时, 凋亡细胞百分率明显高很多。使用健康捐赠者提供的T细胞, Tipifarnib按剂量依赖性降低IFNγ阳性细胞百分率。在沉淀物中, 与DMSO相比, Tipifarnib降低激活型Ras的数量。在体外, Tipifarnib浓度低于10nM时, 选择性在克隆性骨髓增生异常综合征(MDS)造血作用中产生毒性, 当白细胞存在时这种作用更显著。用Tipifarnib处理72小时, 正常MDS前体表达出等量的DiOC3和膜联蛋白V。Tipifarnib和10nM 4-OH-tamoxifen联用, 在有E2存在时, 使IC50值降低8倍, 从400nM降低到50nM。				
体内研究	与单独使用E2处理的肿瘤相比, E2联用R115777处理的肿瘤中Ki-67降低。与分别单独使用Tamoxifen或R115777相比, Tamoxifen和R115777联用导致Ki-67明显降。然而, 在不同组别中凋亡没有明显区别。R115777单独处理也降低CTI。Tamoxifen和R115777或R115777及E2联用作用于降低CTI更有效, 可以导致肿瘤体积降低。				
临床实验	N/A				
特征	A potent and selective farnesyl protein transferase inhibitor with significant antitumor effects.				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	选定的MACS CD34 ⁺ 细胞
浓度	2.5, 10, 25和50nM
处理时间	48小时
方法	选定的MACS CD34 ⁺ 细胞接种在含1%牛血清蛋白的甲基纤维素培养基上, 3U/ml重组人类(rh)促红细胞生成素, 104M 2-巯基乙醇, 2mM L-谷氨酸, 及如下细胞因子: 50ng/ml rh干细胞因子, 20ng/ml rh GM-

	CSF, 20ng/ml rh IL-3, 20ng/ml rh IL-6和20ng/ml rh G-CSF。第一天, 对照组加入DMSO, 实验组分别加浓度为2.5、10、25和50nM的Tipifarnib。在含5% CO ₂ 的湿润孵卵器中37°C环境下温育14天后, 获得群落数。
--	---

动物实验	
动物模型	切除卵巢的雌性Ncr foxhead裸鼠
配制	20% w/v β-环糊精(pH 2.5)
剂量	50mg/kg
给药方式	口服饲喂

➤ **参考文献:**

- 1.Margolin KA, et al. Clin Cancer Res. 2012, 18(4), 1129-1137.
- 2.Bai F, et al. Cancer Immunol Immunother. 2012, 61(4), 523-533.
- 3.Kotsianidis I, et al. Acta Haematol. 2008, 120(1), 51-56.
- 4.Martin LA, et al. Mol Cancer Ther. 2007, 6(9), 2458-2467.
- 5.Krzykowska-Petitjean K, et al. J Cancer Res Clin Oncol. 2012, 138(3), 537-544.
- 6.End DW, et al. Cancer Res. 2001, 61(1), 131-137.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD7185-10mM	Tipifarnib (FTase抑制剂)	10mM×0.2ml
SD7185-5mg	Tipifarnib (FTase抑制剂)	5mg
SD7185-25mg	Tipifarnib (FTase抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01