



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **FGTI-2734**
CAS 号: **1247018-19-4**
产品货号: **S89805**

生物活性:						
Description		FGTI-2734 is a RAS C-terminal mimetic dual farnesyl transferase (FT) and geranylgeranyl transferase-1 (GGT-1) inhibitor with IC50s of 250 nM and 520 nM for FT and GGT-1, respectively. FGTI-2734 can prevent membrane localization of KRAS, hence solving KRAS resistance problem and thwarting mutant KRAS patient-derived pancreatic tumors[1].				
IC50 & Target		IC50: 250 nM (FT) and 520 nM (GGT-1)[1]				
In Vitro		FGTI-2734 (1-30 μM; 72 小时) 在 MiaPaCa2、L3.6pl 和 Calu6 细胞中诱导 CASPASE-3 和 PARP 裂解[1]。 FGTI-2734 (3-30 μM; 72 小时) 抑制 HDJ2、RAP1A、KRAS 和 NRAS 的蛋白质异戊二烯化。 FGTI-2734 在 RAS 转化的小鼠 NIH3T3 细胞和突变的 KRAS 人癌细胞中抑制 KRAS 膜定位[1]。				
		Apoptosis Analysis[1]				
		Cell Line:	MiaPaCa2, L3.6pl and Calu6 cells			
		Concentration:	1, 3, 10, 30 μM			
		Incubation Time:	72 hours			
		Result:	Induced CASPASE-3 and PARP cleavage in MiaPaCa2, L3.6pl and Calu6 cells.			
		Western Blot Analysis[1]				
		Cell Line:	KRAS, HRAS, and NRAS-transformed NIH3T3 cells			
		Concentration:	3, 10, 30 μM			
		Incubation Time:	72 hours			
		Result:	Inhibited both protein prenylation of HDJ2, RAP1A, KRAS and NRAS.			
In Vivo		FGTI-2734 (腹腔内注射; 100 mg/kg/天, 持续 18 至 25 天) 仅抑制突变 KRAS 依赖性肿瘤的肿瘤生长, 但不抑制突变 KRAS 非依赖性肿瘤[1]。				
		Animal Model:	Male SCID-bg mice following injection of MiaPaCa2, L3.6pl, Calu6, A549, H460 and DLD1 cancer cells[1]			
		Dosage:	100 mg/kg			
		Administration:	Intraperitoneally; daily; for 18 to 25 days			
		Result:	Inhibited tumor growth in mutant KRAS-dependent tumors.			
Solvent&Solubility		细胞实验:				
		DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (97.92 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
		Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
			1 mM	1.9584 mL	9.7918 mL	19.5837 mL
			5 mM	0.3917 mL	1.9584 mL	3.9167 mL
	10 mM	0.1958 mL	0.9792 mL	1.9584 mL		
* 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。						
储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (stored under nitrogen)。-80°C 储存时, 请						



	在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 7.5 mg/mL (14.69 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 7.5 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 μL 75.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Kazi A, et al. Dual farnesyl and geranylgeranyl transferase inhibitor thwarts mutant KRAS-driven patient-derived pancreatic tumors. Clin Cancer Res. 2019 Jun 21.

完整储备液配制表:

* 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。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (stored under nitrogen)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.9584 mL	9.7918 mL	19.5837 mL	48.9591 mL
	5 mM	0.3917 mL	1.9584 mL	3.9167 mL	9.7918 mL
	10 mM	0.1958 mL	0.9792 mL	1.9584 mL	4.8959 mL
	15 mM	0.1306 mL	0.6528 mL	1.3056 mL	3.2639 mL
	20 mM	0.0979 mL	0.4896 mL	0.9792 mL	2.4480 mL
	25 mM	0.0783 mL	0.3917 mL	0.7833 mL	1.9584 mL
	30 mM	0.0653 mL	0.3264 mL	0.6528 mL	1.6320 mL
	40 mM	0.0490 mL	0.2448 mL	0.4896 mL	1.2240 mL
	50 mM	0.0392 mL	0.1958 mL	0.3917 mL	0.9792 mL
	60 mM	0.0326 mL	0.1632 mL	0.3264 mL	0.8160 mL
	80 mM	0.0245 mL	0.1224 mL	0.2448 mL	0.6120 mL