



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: shyysw@sina.com

产品名称: **L-778123 (hydrochloride)**
产品别名: **L-778,123 hydrochloride**

生物活性:

Description

L-778123 hydrochloride is an inhibitor of FPTase and GGPTase-I with IC50 of 2 nM and 98 nM in enzyme inhibition determination. IC50 value: 2 nM [1] Target: FPTase in vitro: L-778123 can completely inhibit Ki-Ras prenylation. [1] L-778123 as a farnesyltransferase inhibitor can have a good cytotoxic activity as a classic anti-cancer agent. [2] in vivo: In the dog model, L-778123 inhibits HDJ2 prenylation and produces measurable, albeit slight (5%), levels of unprenylated Rap1A in PBMCs. [1]

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : ≥ 25 mg/mL (56.52 mM)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing	1 mM		2.2607 mL	11.3035 mL	22.6070 mL
Stock Solutions	5 mM		0.4521 mL	2.2607 mL	4.5214 mL
	10 mM		0.2261 mL	1.1304 mL	2.2607 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。 -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。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.25 mg/mL (5.09 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.25 mg/mL (5.09 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例,取 100 μ L 22.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中,混合均匀;向上述体系中加入 50 μ L Tween-80,混合均匀;然后继续加入 450 μ L 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: ≥ 2.25 mg/mL (5.09 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.25 mg/mL (5.09 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例,取 100 μ L 22.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水溶液中,混合均匀。

3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil

Solubility: ≥ 2.25 mg/mL (5.09 mM); Clear solution



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: shyysw@sina.com

	此方案可获得 ≥ 2.25 mg/mL (5.09 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 22.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. Lobell RB, et al. Preclinical and clinical pharmacodynamic assessment of L-778,123, a dual inhibitor of farnesyl:protein transferase and geranylgeranyl:protein transferase type-I. Mol Cancer Ther. 2002 Jul;1(9):747-758. [2]. Ghasemi S, et al. Comparison of Cytotoxic Activity of L778123 as a Farnesyltransferase Inhibitor and Doxorubicin against A549 and HT-29 Cell Lines. Adv Pharm Bull. 2013;3(1):73-77.



源叶生物