



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: **OSU-T315**
CAS 号: **1333146-24-9**
产品货号: **S82868**

生物活性:				
Description	ILK-IN-2 (OSU-T315 analog) 是一种可口服的 PDK2 抑制剂, 也是一种 ILK 抑制剂, IC50 为 0.6 μM。ILK-IN-2 诱导细胞自噬 (Autophagy) 和凋亡 (Apoptosis), 有抗肿瘤活性。ILK-IN-2 通过阻止 AKT 向脂筏的转位直接废除 AKT 的激活, 触发慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 中 Caspase 依赖性凋亡, 延长 TCL1 小鼠模型的生存期。			
IC50 & Target	ILK 0.6 μM (IC50)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	LNCaP	IC50	1.6 μM	Antiproliferative activity against human LNCAP cells assessed as suppression of cell viability by MTT assay
	MCF7	IC50	2.5 μM	Antiproliferative activity against human MCF7 cells assessed as suppression of cell viability by MTT assay
	MDA-MB-231	IC50	1 μM	Antiproliferative activity against human MDA-MB-231 cells assessed as suppression of cell viability by MTT assay
	MDA-MB-468	IC50	1.5 μM	Antiproliferative activity against human MDA-MB-468 cells assessed as suppression of cell viability by MTT assay
	PC-3	IC50	2 μM	Antiproliferative activity against human PC3 cells assessed as suppression of cell viability by MTT assay
	SK-BR-3	IC50	1.8 μM	Antiproliferative activity against human SKBR3 cells assessed as suppression of cell viability by MTT assay
In Vitro	ILK-IN-2 (0-10 μM, 24 h) 对 CLL 衍生细胞系和原代 CLL 细胞均有剂量依赖性的选择性细胞毒性, 但对正常淋巴细胞的影响较小[1]。			
	ILK-IN-2 (4 μM, 16 h) 在 CLL 细胞中降低 Mcl-1 和 Bcl-xl 水平, 触发 CLL 细胞中的 caspase 激活[1]。			
	ILK-IN-2 (1-4 μM, 15 min) 在 Mec-1, OSU-CLL 细胞中不影响 AKT 的近端膜信号传导[1]。			
	ILK-IN-2 (0-5 μM, 24 h) 抑制前列腺癌和乳腺癌细胞系增殖, 对 LNCaP, PC-3, MDA-MB-231, MDA-MB-468, SKBR3, MCF-7 的 IC50 分别为 1.6, 2, 1, 1.5, 1.8, 2.5 μM, 而正常上皮细胞不受影响[2]。			
	ILK-IN-2 (0-4 μM, 24 h) 在 PC3, MDA-MB-231 中抑制 PDK2, 是通过对 Ser-473 位点 Akt 磷酸化的抑制[2]。			
	ILK-IN-2 (0-4 μM, 24 h) 通过细胞自噬和凋亡导致 PC-3 细胞死亡[2]。			
	Cell Viability Assay[1]			
	Cell Line:	Mec-1, OSU-CLL, B cell, T cell		
	Concentration:	0, 2, 4, 6, 8, 10 μM; 0, 1, 2, 3, 4, 5 μM		
	Incubation Time:	24 h		
Result:	Had dose-dependent cytotoxicity against CLL cells, while its cytotoxicity was reduced in normal T cells and B cells.			
Apoptosis Analysis[1]				
Cell Line:	CLL			



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

	Concentration:	4 μ M
	Incubation Time:	16 h
	Result:	Reversed the elevated levels of Mcl-1, significantly enhancing caspase 3/7 activity.
	Western Blot Analysis[1]	
	Cell Line:	Mec-1, OSU-CLL
	Concentration:	1, 2, 3, 4 μ M
	Incubation Time:	15 min
	Result:	Did not disrupt PDK1 phosphorylation, PI3 kinase activity or the activity of Ras interactions with proto-oncogene serine/threonine protein kinases.
	Western Blot Analysis[2]	
	Cell Line:	PC3, MDA-MB-231
	Concentration:	0, 1, 2, 3, 4 μ M; 0, 0.5, 1, 1.5, 2, 2.5 μ M
	Incubation Time:	24 h
	Result:	Showed dose-dependent inhibition of Akt phosphorylation.
	Apoptosis Analysis[2]	
	Cell Line:	PC-3
	Concentration:	0, 1, 2, 3, 4 μ M
	Incubation Time:	24 h
	Result:	Induced cell apoptosis and autophagy simultaneously, and autophagy occurred before cell apoptosis.
In Vivo	ILK-IN-2 (25-50 mg/kg, 口服或腹腔注射, 每天一次, 2-4 周) 延缓小鼠白血病进展, 并显著提高携带 TCL1 白血病细胞的小鼠的总生存率[1]。	
	ILK-IN-2 (25-50 mg/kg, 口服, 每天, 35 天) 抑制裸鼠 PC-3 异种移植瘤的生长[2]。	
	Animal Model:	Pharmacokinetic properties of OSU-T315[1]
	Dosage:	50 mg/kg, daily for 4 weeks; 25 mg/kg, once daily for 2 weeks
	Administration:	Oral; Intraperitoneal injection (i.p.)
	Result:	Reduced white blood cell count and prolonged the survival of mice.
	Animal Model:	PC-3 tumor xenograft mice model[2]
	Dosage:	25, 50 mg/kg; daily; 35 days
	Administration:	Oral
	Result:	Significantly inhibited tumor growth (25 and 50 mg/kg groups inhibited 48% and 62% respectively). Showed that the phosphorylation of Ser-473-Akt was dose-dependently inhibited, while the phosphorylation of Thr-308-Akt was not affected. At the same time, the phosphorylation levels of GSK3 尾 and MLC and the expression levels of YB-1, HER2 and EGFR also appeared in parallel decline.
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (93.70 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)	



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

	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	
		1 mM	1.8741 mL	9.3705 mL	18.7410 mL
		5 mM	0.3748 mL	1.8741 mL	3.7482 mL
		10 mM	0.1874 mL	0.9370 mL	1.8741 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 5 mg/mL (9.37 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 50.0 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。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 5 mg/mL (9.37 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 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 50.0 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]. Ta-Ming Liu, et al. OSU-T315: a novel targeted therapeutic that antagonizes AKT membrane localization and activation of chronic lymphocytic leukemia cells. Blood. 2015 Jan 8;125(2):284-95. [2]. Su-Lin Lee, et al. Identification and characterization of a novel integrin-linked kinase inhibitor. J Med Chem. 2011 Sep 22;54(18):6364-74.				
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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。					
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg



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

DMSO	1 mM	1.8741 mL	9.3705 mL	18.7410 mL	46.8524 mL
	5 mM	0.3748 mL	1.8741 mL	3.7482 mL	9.3705 mL
	10 mM	0.1874 mL	0.9370 mL	1.8741 mL	4.6852 mL
	15 mM	0.1249 mL	0.6247 mL	1.2494 mL	3.1235 mL
	20 mM	0.0937 mL	0.4685 mL	0.9370 mL	2.3426 mL
	25 mM	0.0750 mL	0.3748 mL	0.7496 mL	1.8741 mL
	30 mM	0.0625 mL	0.3123 mL	0.6247 mL	1.5617 mL
	40 mM	0.0469 mL	0.2343 mL	0.4685 mL	1.1713 mL
	50 mM	0.0375 mL	0.1874 mL	0.3748 mL	0.9370 mL
	60 mM	0.0312 mL	0.1562 mL	0.3123 mL	0.7809 mL
	80 mM	0.0234 mL	0.1171 mL	0.2343 mL	0.5857 mL

源叶