



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: **OSU-T315**
CAS 号: **2070015-22-2**
产品货号: **S88563**

生物活性:

Description	OSU-T315 是整联蛋白连接激酶 (ILK) 的抑制剂 (IC ₅₀ =0.6 μM), 通过去磷酸化 AKT-Ser473 和其他 ILK 靶标 (GSK-3β 和肌球蛋白轻链) 抑制 PI3K/AKT 信号传导。OSU-T315 阻止 AKT 转位到脂筏消除 AKT 的活化, 并以 ILK 非依赖性方式触发 Caspase 依赖性细胞凋亡 (Apoptosis)。OSU-T315 通过自噬 (Autophagy) 和凋亡 (Apoptosis) 导致细胞死亡。																								
IC₅₀ & Target	IC ₅₀ : 0.6 μM; Integrin-linked kinase (ILK) inhibitor[1]																								
In Vitro	OSU-T315 (compound 22; 0-5 μM; 处理 24 小时) 对一系列前列腺癌和乳腺癌细胞株显示出较高的体外抑制活性, IC₅₀ 值为 1-2.5 μM[1]。 OSU-T315 (0-2.5 μM; 处理 24 小时) 能够降低 YB-1、HER2 和 EGFR 的表达; 对磷酸化 S6 显示出中等程度的抑制作用, 对磷酸化 ERK1/2 和 磷酸化 p38 表现出剂量依赖性的抑制作用, 而对 PC-3 细胞中磷酸化 JNK 的表达没有影响[1]。 Western Blot Analysis[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>PC-3 cells; MDA-MB-231 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>1 μM, 2 μM, 3 μM, 4 μM; 0.5 μM, 1 μM, 1.5 μM, 2 μM, 2.5 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Exhibited a dose-dependent decreasing effect on the phosphorylation of pS6, ERKs, and p38 in PC-3 cells and MDA-MB-231 cells.</td></tr></table> Cell Viability Assay 聽[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>Prostate cancer cells: LNCaP, PC-3; breast cancer cells: MDA-MB-231, MDA-MB-468, SKBR3, MCF-7; PrEC and MEC cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>0-5 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Suppressed cancer cells viability in breast and prostate cancer cells (IC₅₀, 1-2.5μM).</td></tr></table> Apoptosis Analysis[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>PC-3 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>1 μM, 2 μM, 3 μM, 4 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Induced accumulation of LC3-II and PARP cleavage.</td></tr></table>	Cell Line:	PC-3 cells; MDA-MB-231 cells	Concentration:	1 μM, 2 μM, 3 μM, 4 μM; 0.5 μM, 1 μM, 1.5 μM, 2 μM, 2.5 μM	Incubation Time:	24 hours	Result:	Exhibited a dose-dependent decreasing effect on the phosphorylation of pS6, ERKs, and p38 in PC-3 cells and MDA-MB-231 cells.	Cell Line:	Prostate cancer cells: LNCaP, PC-3; breast cancer cells: MDA-MB-231, MDA-MB-468, SKBR3, MCF-7; PrEC and MEC cells	Concentration:	0-5 μM	Incubation Time:	24 hours	Result:	Suppressed cancer cells viability in breast and prostate cancer cells (IC ₅₀ , 1-2.5μM).	Cell Line:	PC-3 cells	Concentration:	1 μM, 2 μM, 3 μM, 4 μM	Incubation Time:	24 hours	Result:	Induced accumulation of LC3-II and PARP cleavage.
Cell Line:	PC-3 cells; MDA-MB-231 cells																								
Concentration:	1 μM, 2 μM, 3 μM, 4 μM; 0.5 μM, 1 μM, 1.5 μM, 2 μM, 2.5 μM																								
Incubation Time:	24 hours																								
Result:	Exhibited a dose-dependent decreasing effect on the phosphorylation of pS6, ERKs, and p38 in PC-3 cells and MDA-MB-231 cells.																								
Cell Line:	Prostate cancer cells: LNCaP, PC-3; breast cancer cells: MDA-MB-231, MDA-MB-468, SKBR3, MCF-7; PrEC and MEC cells																								
Concentration:	0-5 μM																								
Incubation Time:	24 hours																								
Result:	Suppressed cancer cells viability in breast and prostate cancer cells (IC ₅₀ , 1-2.5μM).																								
Cell Line:	PC-3 cells																								
Concentration:	1 μM, 2 μM, 3 μM, 4 μM																								
Incubation Time:	24 hours																								
Result:	Induced accumulation of LC3-II and PARP cleavage.																								
In Vivo	OSU-T315 (灌胃给药; 25 mg/kg、50 mg/kg; 每日一次; 持续 35 天) 对 PC-3 异种移植瘤的生长具有抑制作用[1]。且实验小鼠未观察到其他明显毒性反应[1]。 <table><tr><td>Animal Model:</td><td>Male NCr athymic nude mice with PC-3 tumor xenografts</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>25 mg/kg; 50 mg/kg</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>Oral gavage; single daily; 35 days</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Resulted in suppression of tumor growth relative to the vehicle control after 35 days of treatment (48% and 62% suppression for 25 and 50 mg/kg, respectively).</td></tr></table>	Animal Model:	Male NCr athymic nude mice with PC-3 tumor xenografts	Dosage:	25 mg/kg; 50 mg/kg	Administration:	Oral gavage; single daily; 35 days	Result:	Resulted in suppression of tumor growth relative to the vehicle control after 35 days of treatment (48% and 62% suppression for 25 and 50 mg/kg, respectively).																
Animal Model:	Male NCr athymic nude mice with PC-3 tumor xenografts																								
Dosage:	25 mg/kg; 50 mg/kg																								
Administration:	Oral gavage; single daily; 35 days																								
Result:	Resulted in suppression of tumor growth relative to the vehicle control after 35 days of treatment (48% and 62% suppression for 25 and 50 mg/kg, respectively).																								
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 260 mg/mL (487.27 mM); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用																								



新开封的 DMSO)				
* "≥" means soluble, but saturation unknown				
Preparing Stock Solutions	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°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时，请在 2 年内使用，-20°C 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: ≥ 2.17 mg/mL (4.07 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 21.7 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: ≥ 2.17 mg/mL (4.07 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 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 21.7 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]. Su-Lin Lee, et al Identification and Characterization of a Novel Integrin-Linked Kinase Inhibitor. J Med Chem. 2011 Sep 22; 54(18): 6364–6374 [2]. Liu TM, 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.			

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, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时，请在 2 年内使用，-20° C 储存时，请在 1 年内使用。



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
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
	100 mM	0.0187 mL	0.0937 mL	0.1874 mL	0.4685 mL

源叶