



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: OTX008
CAS 号: 286936-40-1
产品货号: S89707

生物活性:

Description	OTX008 is a selective inhibitor of galectin-1.				
IC50 & Target	Galectin-1				
In Vitro	OTX008 在大量人类实体瘤细胞系中的生长抑制浓度 (GI50) 范围为 3 - 500 μM。观察到 OTX008 GI50 值与癌细胞组中 Gal1 mRNA (LGALS1) 和蛋白质表达水平之间的显著相关性。在 SQ20B 和 A2780-1A9 细胞中, OTX008 抑制 Gal1 表达以及 ERK1/2 和 AKT 依赖性生存途径, 并通过 CDK1 诱导 G2/M 细胞周期停滞。OTX008 增强 Semaphorin-3A (Sema3A) 在 SQ20B 细胞中的抗增殖作用并逆转外源性 Gal1 诱导的侵袭[1]。OTX008 影响内皮细胞增殖、运动、侵袭和脐带形成。肿瘤细胞增殖也受到抑制, 细胞系之间的敏感性存在差异 (IC50: 1-190 μM)[2]。				
In Vivo	OTX008 抑制皮下移植 A2780-1A9 肿瘤的生长。OTX008 下调肿瘤中 Gal1、Ki67 以及 VEGFR2 的表达, 并降低微血管密度。当 OTX008 首先给药时, OTX008 与多种细胞毒性和靶向疗法具有协同作用[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: Ethanol 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (35.56 mM; 超声助溶) DMSO 中的溶解度 : 5 mg/mL (5.34 mM; 超声助溶 (<60° C); 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	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.0670 mL	5.3352 mL	10.6703 mL
		5 mM	0.2134 mL	1.0670 mL	2.1341 mL
		10 mM	0.1067 mL	0.5335 mL	1.0670 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。 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% EtOH → 90% Saline Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (1.33 mM); 澄清溶液 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 0.5 mg/mL (0.53 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 5.0 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 0.5 mg/mL (0.53 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 5.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水溶液中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 四 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 0.5 mg/mL (0.53 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.5 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 5.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 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: PBS Solubility: 0.5 mg/mL (0.53 mM); 澄清溶液; 超声助溶 (<60°C)
参考文献	[1]. Astorgues-Xerri L, et al. OTX008, a selective small-molecule inhibitor of galectin-1, downregulates cancer cell proliferation, invasion and tumour angiogenesis. Eur J Cancer. 2014 Sep;50(14):2463-77. [2]. Zucchetti M, et al. Pharmacokinetics and antineoplastic activity of galectin-1-targeting OTX008 in combination with sunitinib. Cancer Chemother Pharmacol. 2013 Oct;72(4):879-87.



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

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 (protect from light)。-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 / Ethanol	1 mM	1.0670 mL	5.3352 mL	10.6703 mL	26.6758 mL
	5 mM	0.2134 mL	1.0670 mL	2.1341 mL	5.3352 mL
Ethanol	10 mM	0.1067 mL	0.5335 mL	1.0670 mL	2.6676 mL
	15 mM	0.0711 mL	0.3557 mL	0.7114 mL	1.7784 mL
	20 mM	0.0534 mL	0.2668 mL	0.5335 mL	1.3338 mL
	25 mM	0.0427 mL	0.2134 mL	0.4268 mL	1.0670 mL
	30 mM	0.0356 mL	0.1778 mL	0.3557 mL	0.8892 mL