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：LXS196
产品别名：LXS196

生物活性：

Description	LXS196 is a potent, selective and orally active protein kinase C (PKC) inhibitor, with IC50 values of 1.9 nM, 0.4 nM and 3.1 μM for PKCα, PKCθ and GSK3β, respectively. It can be used for the treatment of uveal melanoma[1][2].		
IC_{50} & Target	PKCα	PKCθ	GSK3β
	1.9 nM (IC_{50})	0.4 nM (IC_{50})	3.1 μM (IC_{50})
In Vitro	Upon oral administration, protein kinase C inhibitor LXS196 binds to and inhibits PKC, which prevents the activation of PKC-mediated signaling pathways. This may lead to the induction of cell cycle arrest and apoptosis in susceptible tumor cells. PKC, a serine/threonine protein kinase overexpressed in certain types of cancer cells, is involved in tumor cell differentiation, proliferation, invasion and survival[1].		
In Vivo	LXS196 (compound 9) (15, 30, 75, 150 mg/kg, P.O., mice) shows improved efficacy (regression) in a 92.1 GNAQ uveal melanoma xenograft model in a dose-dependently manner[2].		
	Animal Model:	Mice implanted with 92.1 GNAQ mutant uveal melanoma cells[2].	
	Dosage:	15, 30, 75, 150 mg/kg	
	Administration:	P.O. (bid) for 35 days	
	Result:	Dose-dependently suppressed the tumor growth.	

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO： ≥ 100 mg/mL (211.65 mM)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.1165 mL	10.5827 mL	21.1654 mL
	5 mM	0.4233 mL	2.1165 mL	4.2331 mL
	10 mM	0.2117 mL	1.0583 mL	2.1165 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.29 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.29 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；

	向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.29 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.29 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。 3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.29 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.29 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
References	[1]. Protein Kinase C Inhibitor LXS196 [2]. US20180179181.