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：LX-2343
CAS 号：333745-53-2
产品货号：S88653

生物活性：

Description	LX2343 是一种 BACE1 酶抑制剂，IC50 值为 11.43±0.36 μM。LX2343 是一种非 ATP 竞争性的 PI3K 抑制剂，IC50 为 15.99±3.23 μM。LX2343 刺激自噬促进 Aβ 清除。

IC50 & Target[1]			
BACE1	PI3K	Aβ	Autophagy
11.43 μM (IC50)	15.99 μM (IC50)		

In Vitro

LX2343 (5-20 μM) dose-dependently decreased Aβ accumulation in HEK293-APPsw and CHO-APP cells, and promotes Aβ clearance in SH-SY5Y cells and primary astrocytes. LX2343 ameliorates cognitive dysfunction in APP/PS1 transgenic mice via both Aβ production inhibition and clearance promotion, which highlights the potential of LX2343 in the treatment of AD. Western blot results in both HEK293-APPsw cells and CHO-APP cells demonstrate that LX2343 fails to regulate BACE1 protein levels, while in vitro BACE1 enzymatic activity assays indicated that LX2343 dose-dependently decreases BACE1 activity (TDC as a positive control) with an IC50 of 11.43±0.36 μM. To test whether competition exists between LX2343 and ATP, we investigated the effects of ATP at different concentrations on the inhibitory activity of LX2343. The result demonstrated that the inhibition of LX2343 against PI3K is virtually unaffected by ATP. Thus, this result suggested that LX2343 is a non-ATP competitive inhibitor of PI3K. In the presence of 10 μM of ATP, the IC50 of LX2343 is 13.11±1.47 μM, in the presence of 50 μM ATP, the IC50 of LX2343 is 13.86±1.12 μM, in the presence of 100 μM ATP, the IC50 of LX2343 is 15.99±3.23 μM [1].

In Vivo

APP/PS1 mice express chimeric human Swedish mutant APP and a mutant human presenilin 1 protein and are widely used as an effective animal model for AD dementia. The amelioration of memory impairment by LX2343 is evaluated t in this model using the MWM test. In 8-d training trials, the path lengths and escape latencies used to find the platform for APP/PS1 transgenic mice are remarkably longer than those for non-transgenic mice, while 10 mg/kg LX2343 administration obviously antagonizes the prolonged path lengths and escape latencies at d 7 and 8. In the probe trial assay, the LX2343-administered transgenic mice cross over the hidden location of the platform more frequently compared with the vehicle-administered transgenic mice[1].

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (210.57 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	2.1057 mL	10.5283 mL	21.0566 mL
	5 mM	0.4211 mL	2.1057 mL	4.2113 mL
	10 mM	0.2106 mL	1.0528 mL	2.1057 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。

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

	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: ≥ 2.5 mg/mL (5.26 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（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；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: ≥ 2.5 mg/mL (5.26 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Guo XD, et al. Small molecule LX2343 ameliorates cognitive deficits in AD model mice by targeting both amyloid β production and clearance. Acta Pharmacol Sin. 2016 Sep;37(10):1281-1297.

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。

可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	**1 mM**	2.1057 mL	10.5283 mL	21.0566 mL	52.6416 mL
	5 mM	0.4211 mL	2.1057 mL	4.2113 mL	10.5283 mL
	10 mM	0.2106 mL	1.0528 mL	2.1057 mL	5.2642 mL
	15 mM	0.1404 mL	0.7019 mL	1.4038 mL	3.5094 mL
	20 mM	0.1053 mL	0.5264 mL	1.0528 mL	2.6321 mL
	25 mM	0.0842 mL	0.4211 mL	0.8423 mL	2.1057 mL
	30 mM	0.0702 mL	0.3509 mL	0.7019 mL	1.7547 mL
	40 mM	0.0526 mL	0.2632 mL	0.5264 mL	1.3160 mL
	50 mM	0.0421 mL	0.2106 mL	0.4211 mL	1.0528 mL

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

	60 mM	0.0351 mL	0.1755 mL	0.3509 mL	0.8774 mL
	80 mM	0.0263 mL	0.1316 mL	0.2632 mL	0.6580 mL
	100 mM	0.0211 mL	0.1053 mL	0.2106 mL	0.5264 mL