

## Apremilast

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
Apremilast	53625ES08	5 mg
	53625ES25	25 mg

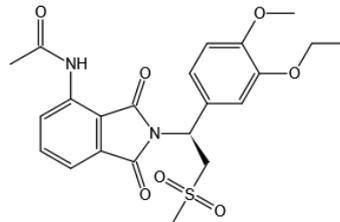
### 产品描述

Apremilast (CC-10004, CC10004), 又称阿普斯特或阿普司特, 是一种可口服的 PDE4 抑制剂,  $IC_{50}$  为 74 nM, 具有抗炎活性, 临床上用于银屑病治疗。Apremilast 通过与 PDE4 相结合, 诱导 cAMP 降解, 调节促炎和抗炎介质产生。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	Apremilast, CC-10004, CC10004
中文名称 (Chinese Name)	阿普斯特, 阿普司特
靶点 (Target)	PDE4, TNF- $\alpha$
通路 (Pathway)	Protease/Metabolic Enzyme--Phosphodiesterase (PDE)
CAS 号 (CAS NO.)	608141-41-9
分子式 (Formula)	$C_{22}H_{24}N_2O_7S$
分子量 (Molecular Weight)	460.50
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

### 结构式 (Structure)



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于  $-20^{\circ}C$ , 有效期 3 年。建议分装后  $-20^{\circ}C$  干燥保存, 避免反复冻融。

### 注意事项

- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
- 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

### 使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

### 使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

### （一）细胞实验（体外实验）

Apremilast 抑制脂多糖诱导的 TNF- $\alpha$ ， $IC_{50}$  为 104 nM ( $pIC_{50}=6.98\pm 0.2$ )，与先前报道的 Apremilast 对外周血单核细胞 PBMCs 的 TNF- $\alpha$ 抑制作用( $IC_{50}=110$  nM)类似。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

在小鼠气囊模型中，口服 Apremilast (5 mg/kg)显著抑制空气袋中 TNF- $\alpha$ 的产生，并减少存在的白细胞数量，降低空气囊膜中的中性粒细胞积聚。<sup>[1]</sup>

### 参考文献

- [1]. Perez-Aso M, et al. Apremilast, a novel phosphodiesterase 4 (PDE4) inhibitor, regulates inflammation through multiple cAMP downstream effectors. *Arthritis Res Ther.* 2015 Sep 15;17:249.
- [2]. Chen LG, et al. Determination of Apremilast in Rat Plasma by UPLC-MS-MS and Its Application to a Pharmacokinetic Study. *J Chromatogr Sci.* 2016 Sep;54(8):1336-40.