



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: **APILIMOD MESYLATE**

CAS 号: **870087-36-8**

产品货号: **S88727**

生物活性:				
Description	Apilimod (STA 5326) mesylate 是 IL-12/IL-23 的有效抑制剂, 抑制人和猴的 PBMC 细胞中的 IL-12, IC50 值为 1 nM 和 2 nM。Apilimod 是一种有效且高度选择性的 PIKfyve 抑制剂。			
IC50 & Target[1][2]	IL-4	IL-5	IL-8	IL-12 IL-23
In Vitro	Apilimod 抑制人 PBMC 中由 IFN- γ /SAC 或 SAC 诱导的 IFN- γ 产生, IC50 约为 20 nM。Apilimod 在高浓度下对来自人 PBMC 的 IFN- γ /SAC 诱导的 TNF- α 和 ConA 诱导的 IL-5 表现出一定的抑制作用, 但对 IL-1 β 、IL-2、IL-4、IL-8、和 IL-18 在所有测试的文化中。p35 和 p40 启动子驱动的荧光素酶活性在用 IFN- γ /LPS 或 IFN- γ /SAC 刺激后显著诱导, 并被 100 nM Apilimod[1] 完全抑制。			
In Vivo	Apilimod (10 mg/kg, po) 不仅在整个实验期间给药时有效, 而且在第 30 天开始给药时也有效, 此时疾病明显可测量但不是最大。Apilimod 仅在 Th1 模型中导致细胞数量显著减少, 相对于载体对照, 平均抑制百分比为 51% $\pm$ 8%。Apilimod 处理对 Th2 设置没有影响[1]。Apilimod (5 或 20 mg/kg, 口服) 降低 EAU 小鼠血清中 IL-12 p40 的水平而不改变体重。通过临床和组织病理学分析, 口服 Apilimod 可降低实验性自身免疫性葡萄膜视网膜炎 (EAU) 的严重程度[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: H2O 中的溶解度 : 100 mg/mL (163.75 mM; 超声助溶) DMSO 中的溶解度 : 12.5 mg/mL (20.47 mM; 超声助溶; 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	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	1.6375 mL	8.1873 mL
		5 mM	0.3275 mL	1.6375 mL
		10 mM	0.1637 mL	0.8187 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 (sealed storage, away from moisture)。-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。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。 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 $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: $\geq$ 1.25 mg/mL (2.05 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 12.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1			



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: shyyysw@sina.com

	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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (2.05 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 12.5 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。 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 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (2.05 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 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 12.5 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: 100 mg/mL (163.75 mM); 澄清溶液; 超声助溶				
参考文献	[1]. Wada Y, et al. Selective abrogation of Th1 response by STA-5326, a potent IL-12/IL-23 inhibitor. Blood. 2007 Feb 1;109(3):1156-64. [2]. Billich A. Drug evaluation: apilimod, an oral IL-12/IL-23 inhibitor for the treatment of autoimmune diseases and common variable immunodeficiency.IDrugs. 2007 Jan;10(1):53-9. [3]. Keino H, et al. Therapeutic effect of the potent IL-12/IL-23 inhibitor STA-5326 on experimental autoimmune uveoretinitis. Arthritis Res Ther. 2008;10(5):R122.				
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 (sealed storage, away from moisture)。-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 / H ₂ O	1 mM	1.6375 mL	8.1873 mL	16.3747 mL	40.9366 mL
	5 mM	0.3275 mL	1.6375 mL	3.2749 mL	8.1873 mL
	10 mM	0.1637 mL	0.8187 mL	1.6375 mL	4.0937 mL
	15 mM	0.1092 mL	0.5458 mL	1.0916 mL	2.7291 mL
	20 mM	0.0819 mL	0.4094 mL	0.8187 mL	2.0468 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: shyyssw@sina.com

H ₂ O	25 mM	0.0655 mL	0.3275 mL	0.6550 mL	1.6375 mL
	30 mM	0.0546 mL	0.2729 mL	0.5458 mL	1.3646 mL
	40 mM	0.0409 mL	0.2047 mL	0.4094 mL	1.0234 mL
	50 mM	0.0327 mL	0.1637 mL	0.3275 mL	0.8187 mL
	60 mM	0.0273 mL	0.1365 mL	0.2729 mL	0.6823 mL
	80 mM	0.0205 mL	0.1023 mL	0.2047 mL	0.5117 mL
	100 mM	0.0164 mL	0.0819 mL	0.1637 mL	0.4094 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶