



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: Nestoron
CAS 号: 7759-35-5
产品货号: S86484

生物活性:

Description	Nestoron (ST-1435) 是一种 19-norprogesterone 衍生物, 对 progesterone receptors 具有高亲和力和选择性, 是一种高度选择性和有效的孕激素, 可用作激素避孕药。				
IC50 & Target	Progesterone Receptors[1]				
In Vivo	Nestoron (400 μ Ci 3H Nestoron/kg BW; subcutaneous injection; female Sprague-Dawley rats) treatment results in the Cmax in the blood and plasma are 58.1 and 95.5 ng equiv. 3H Nestoron/g, with t1/2 of 15.6 hours. Approximately, 81.4% and 7.62% of the administered dose is excreted via feces and urine respectively[1]。				
	Animal Model:	27 adult, female, Sprague-Dawley rats (200-225 g; age: 8 weeks)[1]			
	Dosage:	400 μCi ³ H Nestorone/kg BW			
	Administration:	Subcutaneous injection (Pharmacokinetic study)			
	Result:	The mean peak concentrations of radioactivity (C _{max}) in the blood and plasma were 58.1 and 95.5 ng equiv./g, with t _{1/2} of 15.6 hours. Approximately, 81.4% and 7.62% of the administered dose was excreted via feces and urine, respectively.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (89.96 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	10 mg
		1 mM	2.6992 mL	13.4960 mL	26.9920 mL
		5 mM	0.5398 mL	2.6992 mL	5.3984 mL
		10 mM	0.2699 mL	1.3496 mL	2.6992 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时, 请在 2 年内使用, -20℃ 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。 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 (6.75 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.75 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 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.75 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]. Prasad PV, et al. Single-dose pharmacokinetics of Nestorone, a potential female-contraceptive.Steroids. 2010 Mar;75(3):252-64. Epub 2010 Jan 11. [2]. Hussain R, et al. Progesterone and Nestorone facilitate axon remyelination: a role for progesterone receptors. Endocrinology. 2011 Oct;152(10):3820-31 .

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 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}$ 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	2.6992 mL	13.4960 mL	26.9920 mL	67.4800 mL
	5 mM	0.5398 mL	2.6992 mL	5.3984 mL	13.4960 mL
	10 mM	0.2699 mL	1.3496 mL	2.6992 mL	6.7480 mL
	15 mM	0.1799 mL	0.8997 mL	1.7995 mL	4.4987 mL
	20 mM	0.1350 mL	0.6748 mL	1.3496 mL	3.3740 mL
	25 mM	0.1080 mL	0.5398 mL	1.0797 mL	2.6992 mL
	30 mM	0.0900 mL	0.4499 mL	0.8997 mL	2.2493 mL
	40 mM	0.0675 mL	0.3374 mL	0.6748 mL	1.6870 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

	50 mM	0.0540 mL	0.2699 mL	0.5398 mL	1.3496 mL
	60 mM	0.0450 mL	0.2249 mL	0.4499 mL	1.1247 mL
	80 mM	0.0337 mL	0.1687 mL	0.3374 mL	0.8435 mL



源叶