



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: 4-[[[1R)-2-[5-(2-氟-3-甲氧基苯基)-3-[[2-氟-6-(三氟甲基)苯基]甲基]-3,6-二氢-4-甲基-2,6-二氧化-1(2H)-嘧啶基]-1-苯乙基]氨基]丁酸
产品别名: (R)-Elagolix; 嚒拉戈利; NBI-56418

生物活性:																						
Description		Elagolix is a highly potent, selective, orally-active, short-duration, non-peptide antagonist of the gonadotropin-releasing hormone receptor (GnRHR) (KD = 54 pM). Target: GnRH in vitro: Elagolix is a short-acting, nonpeptide, GnRH antagonist, administered orally, that unlike injectable depot GnRH agonists and antagonists, produces a dose-dependent suppression of ovarian estrogen production, that is, from partial suppression at lower doses to full suppression at higher doses. Elagolix is regarded as the frontrunner of a new class of GnRH inhibitors that have been denoted as second-generation, due to their non-peptide nature and oral bioavailability.																				
		<i>In Vitro:</i> DMSO : ≥ 100 mg/mL (158.33 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.																				
		<table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> Solvent / Mass / Concentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>1.5833 mL</td><td>7.9165 mL</td><td>15.8331 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.3167 mL</td><td>1.5833 mL</td><td>3.1666 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.1583 mL</td><td>0.7917 mL</td><td>1.5833 mL</td></tr></table>				Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	1.5833 mL	7.9165 mL	15.8331 mL	5 mM	0.3167 mL	1.5833 mL	3.1666 mL	10 mM	0.1583 mL	0.7917 mL	1.5833 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg																		
	1 mM	1.5833 mL	7.9165 mL	15.8331 mL																		
	5 mM	0.3167 mL	1.5833 mL	3.1666 mL																		
	10 mM	0.1583 mL	0.7917 mL	1.5833 mL																		
Solvent&Solubility		*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。																				
		<i>In Vivo:</i>																				
		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 (3.96 mM); Clear solution																				
		此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (3.96 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 (3.96 mM); Clear solution																				
		此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (3.96 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。																				



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

	3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.96 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (3.96 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]. Carr B, et al. Elagolix, an oral GnRH antagonist, versus subcutaneous depot medroxyprogesterone acetate for the treatment of endometriosis: effects on bone mineral density. Reprod Sci. 2014 Nov;21(11):1341-1351.



源叶生物