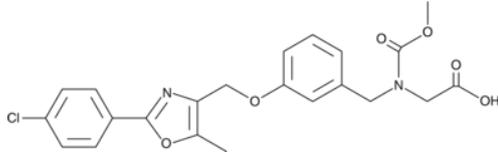


BMS-687453 ; BMS687453

产品编号：MB0227
 质量标准：>98%,BR
 包装规格：5MG；25MG
 产品形式：白色至类白色固体

基本信息

分子式	C22H21ClN2O6	结 构 式	
分子量	444.86		
CAS No.	1000998-59-3		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: ≥ 31 mg/mL		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体
 溶解性：.....DMSO: ≥ 31 mg/mL
 纯度：.....>98%，BR

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展：

心脑血管疾病已被世界卫生组织(WHO)认定为危害人类健康的头号杀手。中国是心脑血管疾病发病率较高的国家,因此,开发高效的心脑血管疾病药物刻不容缓。研究表明 PPARs 与心脑血管疾病的发病机制密切相关,因而,PPARs 激动剂已成为心脑血管疾病药物研究的热点。PPARs 是一类由配体激活的转录因子,属于Ⅱ型核受体超家族成员,其主要功能是通过作用于靶基因的启动子来调节基因转录而发挥多种生理作用,在肝脂肪和脂肪细胞的分化与生成、炎症因子生成及炎症反应、动脉粥样硬化、脂质代谢等方面有着重要的作用。研究发现化合物 BMS-687453 是一种有效的,选择性的 PPAR α 激动剂。PPAR 家族的转录因子,对血浆有多效的影响。可用于相关脂蛋白水平,胰岛素敏感,动脉粥样硬化和炎症治疗等科学研究。

产品描述	BMS-687453 是一种有效的,选择性的 PPAR α 激动剂。
靶点	PPAR α 260 nM (IC50, Human PPAR α)
体外研究	BMS-68 753 是 PPAR α 激动剂 其 PPAR α 的 EC50 和 IC50 分别为 10 nm 和 260 nm 在 PPAR-GAL4 反式激活试验中, PPAR α 的效果达到 PPAR γ 的 410 倍和 57 倍, 以上的选择性分别为 4100 nm 和 15000 nm。BMS-68 753 在 HepG2 细胞中具有较高的 PPAR α 效价 (EC50 = 47 nm), 其选择性对比 PPAR γ (EC50 = 2400 nm) 有 50 倍的活性。然而, BMS-68 753 在啮齿类动物 PPAR α 功能测定中显示出不太有效的活性, 对于小鼠而言, EC50 为 426 nm, 仓鼠为 488 nm, 但在这两个物种中仍然是完整的 PPAR α 激动剂。

体内研究	BMS-687453 (10,50,100 , p.o.) 剂量依赖增加小鼠血清 ApoA1 蛋白水平和低密度脂蛋白 - 胆固醇 (LDLc) 水平。 BMS-687453 (1,3,10 mg / kg , 口服) 可降低高脂喂养的仓鼠的 HDLc 水平。 BMS-687453 在肝中诱导 PDK4 mRNA 其 ED50 值为 0.24mg / kg 。 BMS-687453 (300mg / kg , 口服) 导致骨骼肌纤维变性和坏死, 其特征在于观察到的雄性大鼠的盘状改变, 肌原纤维溶解, 透明化和细胞浸润。 BMS-687453 (300 mg / kg , p.o.) 在雄性大鼠的快肌和慢肌中都有轻度毒性。
-------------	---

美仑相关产品推荐

MB0225	GW7647	GW-7647
MB0226	GW590735	GW-590735
MB3709	GW0742	GW-0742
MB7303	GW501516	GW-501516
MB5023	GW 9662	2-氯-5-硝基苯甲酰胺;GW-9662
MB3813	GSK3787	GSK-3787
MB4844	L-165041	L165041
MB3812	T0070907	T-0070907

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。 BMS-687453 是一种有效的, 选择性的 PPAR α 激动剂, PPAR 家族的转录因子, 对血浆有多效的影响。可用于相关脂蛋白水平, 胰岛素敏感, 动脉粥样硬化和炎症治疗等科学研究。

储液配置

浓度	质量 / 体积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2479 mL	11.2395 mL	22.4790 mL
5 mM	0.4496 mL	2.2479 mL	4.4958 mL
10 mM	0.2248 mL	1.1239 mL	2.2479 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	使用均相荧光极化 PPAR α 和 PPAR γ 结合测定法作为测定化合物的 PPAR α 和 PPAR γ 结合亲和力的主要筛选。 通过使用 GAL4-LBD 测定来确定 PPAR α 和 PPAR γ 激动剂的人功能活性。 以嵌合 GAL4 /PPAR α 测定形式测试体外仓鼠, 大鼠和小鼠 PPAR α 功能活性。 数据报告为使用 XLfit 4 参数拟合和浮动所有参数计算的 EC50 值。 在 HepG2 细胞中采用全长人 PPAR α 和 PPAR γ 共转染试验用于进一步测试先导化合物 (BMS-687453)。
动物实验	BMS-687453 在 97.5%Gibco 蒸馏水中的 2%吐温 80 和 0.5%CMC (羧甲基纤维素) 中配制。 雄性 6-8 周龄的人 apoA1 转基因小鼠被随机分配到不同的治疗组中, 并且通过口服强饲法 (5mL / kg 体重) 在早晨每天一次单独或与化合物 (BMS-687453) 和 允许免费获得食物和水。 研究期限为 10 天。 在第 10 天给药后, 将小鼠禁食 4 小时并通过 CO2 窒息处死, 并且通过心脏穿刺将血液样品收集在血清分离管中用于脂质测量。 解剖出肝脏, 称重并迅速冷冻在液氮中用于未来的 RNA 分析。

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。