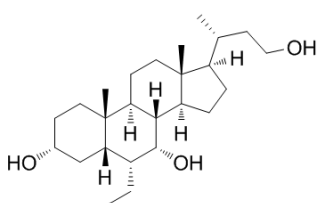


## BAR502 ; BAR-502

产品编号：MB6109  
 质量标准：>98%,BR  
 包装规格：1MG；5MG  
 产品形式：白色至类白色固体

### 基本信息

分子式	C <sub>25</sub> H <sub>44</sub> O <sub>3</sub>	结 构 式	
分子量	392.62		
CAS No.	1612191-86-2		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	10 mM in DMSO		
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。		

**简介：**BAR502 是 FXR 和 GPBAR1 的双重激动剂，IC<sub>50</sub> 值分别为 2 μM 和 0.4 μM

**别名：**24-Norcholeane-3,7,23-triol, 6-ethyl-, (3α,5β,6α,7α)

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体  
 溶解性：.....10 mM in DMSO  
 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：

非酒精性脂肪性肝炎 (NASH) 是一种非常普遍的慢性肝病。在这里，我们研究了用于 FXR 和 GPBAR1 的非胆汁酸甾体双重配体 BAR502 是否逆转喂食高脂饮食 (HFD) 和果糖的小鼠中的脂肪肝。9 周后，HFD 小鼠增加 ≈30% 的 b.w (与初始相比，P < 0.01) 并且是胰岛素抵抗的。这些超重和胰岛素抵抗小鼠随机接受 HFD 或 HFD 联合 BAR502。18 周后，HFD 小鼠出现 NASH 样特征，伴有严重的脂肪肝和肝纤维化，肝脏中甘油三酯和胆固醇含量升高，SREPB1c, FAS, ApoC2, PPARα 和 γ, α-SMA, α1 胶原和 MCP1 mRNA 表达增加。用 BAR502 治疗导致体重减少约 10%，增加胰岛素敏感性和循环水平的 HDL，同时降低脂肪变性，炎症和纤维化评分以及 SREPB1c, FAS, PPARγ, CD36 和 CYP7A1 mRNA 的肝脏表达。BAR502 增加肝脏中 SHP 和 ABCG5 的表达，增加肠道中 SHP, FGF15 和 GLP1 的表达。BAR502 促进了 epWAT 的褐变并减少了由 CCl<sub>4</sub> 诱导的肝纤维化。总而言之，双重 FXR 和 GPBAR1 激动剂 BAR502 通过促进脂肪组织的褐变来保护免受 HFD 引起的肝损伤。

### 生物活性

<b>产品描述</b>	BAR502 是 FXR 和 GPBAR1 的双重激动剂，IC <sub>50</sub> 值分别为 2 μM 和 0.4 μM
<b>靶点</b>	IC <sub>50</sub> : 2 μM (FXR), 0.4 μM (GPBAR1)
<b>体外研究</b>	BAR502 是一种截短的侧链醇，在 α 构型的环 B 上都有取代基。在 10 μM 的浓度下，BAR502 不能分别激活 GR、PPARγ 和 LXR，但反式激活了核受体 PXR。BAR502 能够诱导 GLTAG 细胞中的促胰高血糖素 mRNA 的表达，并增加 THP-1 细胞中 cAMP 的浓度。BAR502 诱导 HepG2 细胞中

	OST $\alpha$ 、BSEP 和 SHP 的表达。BAR502 在 SRC-1 共激活剂募集和 FXR 高亲和力方面表现出非常有效的活性。
<b>体内研究</b>	BAR502 的治疗可使 B.W 降低 10%，增加胰岛素敏感性和循环 HDL 水平，同时降低 SrbB1c、Fas、PPAR $\gamma$ 、CD36 和 CYP7A1 mRNA 的脂肪变性、炎症和纤维化评分和肝脏表达。BAR502 增加了肝组织中 SHP 和 ABCG5 的表达，并增加了小肠中的 SHP、FGF15 和 GLP1 的表达。BAR502 促进 EPWAT 褐变，减少 CCl4 诱导的肝纤维化。在非梗阻性胆汁淤积模型中，BAR502 可减轻肝脏损伤而不引起瘙痒。与 BAR502 联合治疗可增加存活率，降低血清碱性磷酸酶水平，并能稳健调节 FXR 靶基因（包括 OST $\alpha$ 、BSEP、SHP 和 MDR1）的肝脏表达，而不引起瘙痒。

**美仑相关产品推荐**

MB6107	AMG-3969	AMG3969
MB6088	AZD1656	AZD-1656
MB6159	muraglitazar	BMS-298585
MB3812	T0070907	T-0070907
MB0589	PGPC	1-palmitoyl-2-glutaryl-sn-glycero-3-phosphocholine
MB0225	GW7647	GW-7647
MB0226	GW590735	GW-590735
MB0227	BMS-687453	BMS687453
MB3709	GW0742	GW-0742
MB7303	GW501516	GW-501516
MB5023	GW 9662	2-氯-5-硝基苯甲酰苯胺;GW-9662
MB3813	GSK3787	GSK-3787
MB4844	L-165041	L165041

**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。双重 FXR 和 GPBAR1 激动剂 BAR502 通过促进脂肪组织的褐变来保护免受 HFD 引起的肝损伤。可用于相关科研领域的研究。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.5470 mL	12.7350 mL
	5 mM	0.5094 mL	2.5470 mL	5.0940 mL
	10 mM	0.2547 mL	1.2735 mL	2.5470 mL

**经典实验操作（仅供参考）**

<b>动物实验</b>	Ba502 是用 1%甲基纤维素在饮用水中制备的。 小鼠：24 周龄的 C57BL6 小鼠饲喂含 60% kJ 脂肪和果糖的高脂饮食（饮用水）（42 g/L）或正常饮食（6 只小鼠）18 周。10 周的 HFD 后，小鼠随机接受 HFD 单独（9 只）或 HFD 加 BAR502（15 毫克/公斤/天）的体重通过灌胃（9 只小鼠）8 周。将小鼠置于受控温度（22°C）和光周期（12:12
-------------	--

	小时光/暗循环)中,允许不受限制地进入标准的小鼠饲料和自来水,并允许在至少 5 天的条件下适应这些条件,然后加入实验中。
--	--

**【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。