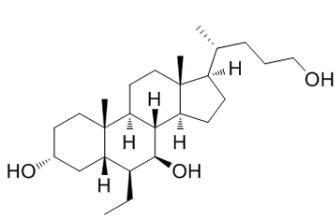


BAR501 ; BAR-501

产品编号：MB6110
 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 ₂₆ H ₄₆ O ₃	结 构 式	
分子量	406.64		
CAS No.	1632118-69-4		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	10 mM in DMSO Water < 1mg/ml Ethanol < 1mg/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。		

简介：BAR501 是高效选择性的 GPBAR1 激动剂，EC₅₀ 值为 1 μM。

别名：(3α,5β,6β,7β)-6-ethyl-cholane-3,7,24-triol

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....10 mM in DMSO；Water < 1mg/ml；Ethanol < 1mg/ml

纯度：.....>98%，BR

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展：

GPBAR1 是一种在肠肝组织中表达的胆汁酸激活受体。在肝脏中，GPBAR1 的表达仅限于正弦和 Kupffer 细胞。GPBAR1 激动剂引起的全身循环血管舒张中，通过抑制胱硫醚-γ-淀粉酶（CSE）来消除，这是产生硫化氢（H₂S）的一种酶，一种血管舒张剂。BAR501 是一种半合成的胆汁酸衍生物，赋予 GPBAR1 一种有效的和选择性的激动活性。通过转活化实验，证明 BAR501 是一种选择性 GPBAR1 激动剂，没有任何 FXR 激动活性。在单纯大鼠中，BAR501 能有效降低肝灌注压力，抑制去甲肾上腺素的血管收缩活性。在 CCl₄ 模型中，使用 BAR501 治疗 9 周，通过增加肝脏 CSE 表达和活性，减少内皮素(ET)-1 基因表达，有效防止内皮功能障碍的发生。在喂食蛋氨酸的小鼠中，使用 BAR501 治疗可减轻内皮功能障碍，并引起依赖于 gpbar1 的 CSE 调控。利用人类肝脏正弦信号细胞，我们发现 CSE 表达/活性的调节受到基因组(CSE 启动子中 CREB 向 CRE 的募集)和非基因组效应的介导，涉及 akt 依赖的 CSE 和内皮一氧化氮合酶(NO)。BAR501 使 FOXO1 磷酸化，抑制肝窦状细胞中的 ET-1 转录。

产品描述	BAR501 是高效选择性的 GPBAR1 激动剂
靶点	EC ₅₀ : 1 μM (GPBAR1) ¹
体外研究	BAR501 是一种缺乏 FXR 激动活性的选择性 GpBAR1 激动剂。它能有效地将 GPBAR1 在 GEPAR1 过表达 CRE 的 HEK293 细胞中激活，EC ₅₀ 为 1μm。GalTAG 细胞暴露于 BAR501 (10μm) 后，

	GLP-1 mRNA 的表达增加了 2.5 倍。
体内研究	用 BAR501, 15 mg/kg 预处理大鼠 6 天, 可降低基础门静脉压力, 减弱去甲肾上腺素的血管收缩活性。BAR501 预处理可减轻剪切应力和甲氧胺引起的肝血管舒缩活性。BAR501 的给药在 CCl4 模型中发挥直接的血管舒张活性。用 15 mg/kg 剂量的 BAR501 处理小鼠可降低门静脉压力和 AST 血浆水平。BAR501 通过调节 CSE 表达/活性减轻内皮功能障碍

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。BAR501 是一种选择性 GPBAR1 激动剂，没有任何 FXR 激活活性。可用于肝硬化、肝脏功能异常等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	2.4592 mL	12.2959 mL
5 mM	0.4918 mL	2.4592 mL	4.9184 mL	
10 mM	0.2459 mL	1.2296 mL	2.4592 mL	

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	对于 GpBAR1 介导的反式激活, HEK-29 3T 细胞在 24 孔板上电镀 10000 个细胞/孔, 并用 200 ng 的 pGL4.29 转染, 该载体含有 cAMP 应答元件 (CRE), 其驱动荧光素酶报告基因 LUC2P 的转录, 具有 100 ng 的 PCMVSPART6 HUM. GPBAR1, 并具有 100 ng PGL4.70. 转染后 24 h, HepG2 和 HEK29 3T 细胞与 10 μ M BAR501 共孵育 18 h, 测定荧光素酶活性, 并与 Renilla 活性进行归一化处理。
动物实验	小鼠 :C57BL6 小鼠每周给药 500 μ L/kg 体重的 CCl4 等量石蜡油 9 周。CCl4 小鼠随机接受 BAR501 (每天灌胃 15 毫克/公斤) 或车辆 (蒸馏水)。常规生化测定血清胆红素、白蛋白、天门冬氨

酸转氨酶、丙氨酸转氨酶和碱性磷酸酶

【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。