



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: shyyssw@sina.com

产品名称: **BAR501**
CAS 号: **1632118-69-4**
产品货号: **S87657**

生物活性:

Description	BAR501 是高效选择性的 GPBAR1 激动剂, EC50 值为 1 μM。				
IC50 & Target	EC50: 1 μM (GPBAR1)[1].				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	EC50	1.03 μM	Agonist activity at GP-BAR1 (unknown origin) in human HEK293 cells assessed as receptor transactivation at 100 nM to 50 uM incubated for 16 hrs by CRE-driven luciferase reporter gene assay	
In Vitro	BAR501 is a selective GPBAR1 agonist devoid of FXR agonistic activity. It effectively transactivates GPBAR1 in HEK293 cells overexpressing a CRE along with GPBAR1, with an EC50 of 1 μM. Exposure of GLUTAg cells to BAR501 (10 μM) increases the expression of GLP-1 mRNA by 2.5 folds[1].				
In Vivo	Pretreating rats for 6 days with BAR501, 15 mg/kg, reduces basal portal pressure and blunts the vasoconstriction activity of norepinephrine. Pretreatment with BAR501 attenuates the hepatic vasomotor activity induced by shear stress and methoxamine. Administration of BAR501 exerts a direct vasodilatory activity in the CCl4 model. Treating mice with BAR501 at the dose of 15 mg/Kg reduces portal pressure and AST plasma levels. BAR501 attenuates endothelial dysfunction by regulating CSE expression/activity[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: Ethanol 中的溶解度 : 120 mg/mL (295.10 mM; 超声助溶) DMSO 中的溶解度 : ≥ 50 mg/mL (122.96 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.4592 mL	12.2959 mL	24.5918 mL
		5 mM	0.4918 mL	2.4592 mL	4.9184 mL
		10 mM	0.2459 mL	1.2296 mL	2.4592 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°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 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% EtOH → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 3 mg/mL (7.38 mM); 澄清溶液					



	此方案可获得 $\geq 3 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \text{ }\mu\text{L}$ 30.0 mg/mL 的澄清 EtOH 储备液加到 $900 \text{ }\mu\text{L}$ 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 二 请依序添加每种溶剂: 10% EtOH $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq 3 \text{ mg/mL}$ (7.38 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 3 \text{ mg/mL}$ (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 $100 \text{ }\mu\text{L}$ 30.0 mg/mL 的澄清 EtOH 储备液加到 $900 \text{ }\mu\text{L}$ 玉米油中, 混合均匀。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (6.15 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \text{ }\mu\text{L}$ 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $400 \text{ }\mu\text{L}$ PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 $50 \text{ }\mu\text{L}$ Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 $450 \text{ }\mu\text{L}$ 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 ddH_2O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 四 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (6.15 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \text{ }\mu\text{L}$ 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \text{ }\mu\text{L}$ 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 五 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (6.15 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.5 \text{ mg/mL}$ (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 $100 \text{ }\mu\text{L}$ 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \text{ }\mu\text{L}$ 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Renga B, et al. Reversal of Endothelial Dysfunction by GPBAR1 Agonism in Portal Hypertension Involves a AKT/FOXO1 Dependent Regulation of H2S Generation and Endothelin-1. PLoS One. 2015 Nov 5;10(11):e0141082.
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°C, 2 years; -20°C, 1 year. -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。	



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: shyyssw@sina.com

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO/ Ethanol	1 mM	2.4592 mL	12.2959 mL	24.5918 mL	61.4794 mL
	5 mM	0.4918 mL	2.4592 mL	4.9184 mL	12.2959 mL
	10 mM	0.2459 mL	1.2296 mL	2.4592 mL	6.1479 mL
	15 mM	0.1639 mL	0.8197 mL	1.6395 mL	4.0986 mL
	20 mM	0.1230 mL	0.6148 mL	1.2296 mL	3.0740 mL
	25 mM	0.0984 mL	0.4918 mL	0.9837 mL	2.4592 mL
	30 mM	0.0820 mL	0.4099 mL	0.8197 mL	2.0493 mL
	40 mM	0.0615 mL	0.3074 mL	0.6148 mL	1.5370 mL
	50 mM	0.0492 mL	0.2459 mL	0.4918 mL	1.2296 mL
	60 mM	0.0410 mL	0.2049 mL	0.4099 mL	1.0247 mL
	80 mM	0.0307 mL	0.1537 mL	0.3074 mL	0.7685 mL
	100 mM	0.0246 mL	0.1230 mL	0.2459 mL	0.6148 mL

源叶