



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: **BAR 502**
CAS 号: **1612191-86-2**
产品货号: **S88440**

生物活性:					
Description	BAR502 是 FXR 和 GPBAR1 的双重激动剂, IC50 值分别为 2 μM 和 0.4 μM。				
IC50 & Target	IC50: 2 μM (FXR), 0.4 μM (GPBAR1)[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HEK293	EC50	0.4 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	
	HepG2	EC50	2 μM	Agonist activity at FXR (unknown origin) expressed in human HepG2 cells assessed as receptor transactivation at 100 nM to 50 uM incubated for 16 hrs by FXR response element driven HSP27-TK-luciferase reporter gene assay	
In Vitro	BAR502 is a truncated side chain alcohol with both substituents on ring B in α-configuration. At the concentration of 10 μM, BAR502 fails to transactivate GR, PPAR γ, and LXR, respectively, but it transactivates the nuclear receptor PXR. BAR502 is able to induce the expression of pro-glucagon mRNA in GLUTAg cells, an intestinal endocrine cell line, as well as to increase cAMP concentrations in THP-1 cells. BAR502 induces the expression of OST α, BSEP, and SHP in HepG2 cells. BAR502 shows a very potent activity in the recruitment of SRC-1 coactivator and high affinity to FXR[1]				
In Vivo	Treatment with BAR502 causes a 10% reduction of b.w., increases insulin sensitivity and circulating levels of HDL, while reduces steatosis, inflammatory and fibrosis scores and liver expression of SREPB1c, FAS, PPAR γ, CD36 and CYP7A1 mRNA. BAR502 increases the expression of SHP and ABCG5 in the liver and SHP, FGF15 and GLP1 in intestine. BAR502 promotes the browning of epWAT and reduces liver fibrosis induced by CCl4[2]. In models of non-obstructive cholestasis, BAR502 attenuates liver injury without causing itching. Co-treatment with BAR502 increases survival, attenuates serum alkaline phosphatase levels and robustly modulates the liver expression of canonical FXR target genes including OST α, BSEP, SHP and MDR1, without inducing pruritus[3].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMF 中的溶解度 : 50 mg/mL (127.35 mM; 超声助溶) Ethanol 中的溶解度 : ≥ 50 mg/mL (127.35 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.5470 mL	12.7350 mL	25.4699 mL
		5 mM	0.5094 mL	2.5470 mL	5.0940 mL
		10 mM	0.2547 mL	1.2735 mL	2.5470 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.37 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（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 EtOH 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 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 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% EtOH → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.37 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（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 EtOH 储备液加到 900 μL 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 三 请依序添加每种溶剂： 10% EtOH → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.37 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 EtOH 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀
参考文献	[1]. Festa C, et al. Exploitation of cholane scaffold for the discovery of potent and selective farnesoid X receptor (FXR) and G-protein coupled bile acid receptor 1 (GP-BAR1) ligands. J Med Chem. 2014 Oct 23;57(20):8477-95. [2]. Carino A, et al. BAR502, a dual FXR and GPBAR1 agonist, promotes browning of white adipose tissue and reverses liver steatosis and fibrosis. Sci Rep. 2017 Feb 16;7:42801. [3]. Cipriani S, et al. Impaired Itching Perception in Murine Models of Cholestasis Is Supported by Dysregulation of GPBAR1 Signaling. PLoS One. 2015 Jul 15;10(7):e0129866.

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。

可选溶剂	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积				
	浓度				



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: shyyw@sina.com

DMF / Ethanol	1 mM	2.5470 mL	12.7350 mL	25.4699 mL	63.6748 mL
	5 mM	0.5094 mL	2.5470 mL	5.0940 mL	12.7350 mL
	10 mM	0.2547 mL	1.2735 mL	2.5470 mL	6.3675 mL
	15 mM	0.1698 mL	0.8490 mL	1.6980 mL	4.2450 mL
	20 mM	0.1273 mL	0.6367 mL	1.2735 mL	3.1837 mL
	25 mM	0.1019 mL	0.5094 mL	1.0188 mL	2.5470 mL
	30 mM	0.0849 mL	0.4245 mL	0.8490 mL	2.1225 mL
	40 mM	0.0637 mL	0.3184 mL	0.6367 mL	1.5919 mL
	50 mM	0.0509 mL	0.2547 mL	0.5094 mL	1.2735 mL
	60 mM	0.0424 mL	0.2122 mL	0.4245 mL	1.0612 mL
	80 mM	0.0318 mL	0.1592 mL	0.3184 mL	0.7959 mL
	100 mM	0.0255 mL	0.1273 mL	0.2547 mL	0.6367 mL

源叶