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：shyysw@sina.com

产品名称：PHPS1
CAS 号： 314291-83-3
产品货号：S89265

生物活性：

Description

PHPS1 是一种有效的选择性 Shp2 抑制剂，对 Shp2，Shp2-R362K，Shp1，PTP1B 和 PTP1B-Q 的 Ki 值分别为 0.73，5.8，10.7，5.8 和 0.47 μM。

IC50 & Target

Ki: 0.73 μM (Shp2), 5.8 μM (Shp2-R362K), 10.7 μM (Shp1), 5.8 μM (PTP1B), 0.47 μM (PTP1B-Q)[1]

In Vitro

PHPS1 (30 μM；6 天) 抑制人类肿瘤细胞的增殖[1]。

PHPS1 (5-20 μM；5-360 min) 抑制 Erk1/2 但不抑制 Akt 和 Stat3 剂量依赖性磷酸化[1]。

Cell Viability Assay[1]

Cell Line:	Human cancer cell lines MDA-MB-435, HCT-116 (colon carcinoma), HCT-15 (colon carcinoma), PC-3 (prostate carcinoma) HT-29 (colon carcinoma), NCI-H661 (lung carcinoma), and Caki-1 (kidney carcinoma)
Concentration:	30 μM
Incubation Time:	6 days
Result:	Resulted in a reduction in cell number of between 0% (Caki-1) to 74% (HT-29).

Western Blot Analysis[1]

Cell Line:	Madin-Darby canine kidney (MDCK) cells
Concentration:	5, 10, 20 μM
Incubation Time:	5, 15, 60, 120, 360 minutes
Result:	Inhibited HGF/SF (1 unit/mL)-induced phosphorylation and thus activation of Erk1/2 over a time period of 15 min to 6 h. In contrast, transient phosphorylation of Erk1/2 after 5 min was not affected. Exhibited no effect on HGF/SF-induced activation of PI3K/Akt or Stat3.

In Vivo

PHPS1 (3 mg/kg；i.p.；高脂肪饮食的最后一周的每一天) 使 Ldlr-/- 小鼠不易发生动脉粥样硬化[2]。

Animal Model:	Ldlr-/- (005061) mice[2]
Dosage:	3 mg/kg
Administration:	Intraperitoneal (i.p.) injection; every day during the last week on the high-fat diet.
Result:	Revealed a significant decrease in atherosclerotic plaque size in the aorta compared with the other two groups.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (53.71 mM; 超声助溶 (<60°C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响，请使用新开封的 DMSO)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.1485 mL	10.7425 mL	21.4850 mL
	5 mM	0.4297 mL	2.1485 mL	4.2970 mL

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：shyysw@sina.com

		10 mM	0.2149 mL	1.0743 mL	2.1485 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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。				
参考文献	[1]. Klaus Hellmuth, et al. Specific Inhibitors of the Protein Tyrosine Phosphatase Shp2 Identified by High-Throughput Docking. Proc Natl Acad Sci U S A. 2008 May 20;105(20):7275-80. [2]. Jia Chen, et al. SHP2 Inhibitor PHPS1 Protects Against Atherosclerosis by Inhibiting Smooth Muscle Cell Proliferation. BMC Cardiovasc Disord. 2018 Apr 27;18(1):72.				

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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	**质量 / 溶剂体积 / 浓度**	**1 mg**	**5 mg**	**10 mg**	**25 mg**
DMSO	**1 mM**	2.1485 mL	10.7425 mL	21.4850 mL	53.7126 mL
	5 mM	0.4297 mL	2.1485 mL	4.2970 mL	10.7425 mL
	10 mM	0.2149 mL	1.0743 mL	2.1485 mL	5.3713 mL
	15 mM	0.1432 mL	0.7162 mL	1.4323 mL	3.5808 mL
	20 mM	0.1074 mL	0.5371 mL	1.0743 mL	2.6856 mL
	25 mM	0.0859 mL	0.4297 mL	0.8594 mL	2.1485 mL
	30 mM	0.0716 mL	0.3581 mL	0.7162 mL	1.7904 mL
	40 mM	0.0537 mL	0.2686 mL	0.5371 mL	1.3428 mL
	50 mM	0.0430 mL	0.2149 mL	0.4297 mL	1.0743 mL