メルクミリポア
阻害剤カタログ 2014

Calbiochem ブランド阻害剤製品の最新情報を掲載。
各研究カテゴリごとにまとめた 1600 品目におよぶ製品をご覧いただけます。



Calbiochem®

Merck Millipore is a division of MERCK

キナーゼ創薬に最適
プロテインキナーゼ阻害剤ライブラリーシリーズ

InhibitorSelect™
Protein Kinase Library Series

InhibitorSelect Protein Kinase Inhibitor Library はプロテインキナーゼ阻害剤のセットです。
96-well または 384-well に 80~160 種類のプロテインキナーゼ阻害剤を濃度 10 mM（一部 5 mM）、
DMSO 溶液を分注済みです。

未知の阻害剤のスクリーニング | **新規プロテインキナーゼの選別** | ***in vivo* での分析**

InhibitorSelect 96-Well Protein Kinase Inhibitor Library I

標的キナーゼ

Akt	Aurora
Bcr-Abl	DAG
DNA-PK	EGFR
FLT3	Cfms
IGFR	IRAK
JAK	Lck
c-Met	p70 S6
PDGFR	PDK1
PI3-K	PKC
PKR	Rho
Src	Syk
TGF-bR	VEGFR

系統別阻害剤数（重複有）

Kinome	
TK	50
AGC	17
Atypical	9
TKL	3
Other	5

InhibitorSelect 96-Well Protein Kinase Inhibitor Library II

標的キナーゼ

AMPK	ATM
ATR	Aurora
CaMK	Cdks
Chk1,2	CK1, 2
ERK	GSK-3
IKK	JNK
MAPK	MEK
MNK1	SK

系統別阻害剤数（重複有）

Kinome	
CMGC	52
CAMK	10
AGC	6
CK1	5
TK	5
STE	4
OTHER	11

InhibitorSelect 96-Well Protein Kinase Inhibitor Library III

標的キナーゼ

Adenosine Kinase		Akt
Aurora	Bcr-Abl	CaMK
Cdks	Chk 1,2	c-Kit
CK1, 2	DNA-PK	eEF2
GSK-3	IKK	IP3K
Lck	MAPK	MAPKAPK2
MEK	MLCK	Myt1
P90RSK	PAK	PI3-K
PIKFyve	PIM	PKA
PKC	PKG	Plk
Ras/Rac	Rho	RIPK1
Src	Ste11	Tpl2
Wee1	-	-

系統別阻害剤数（重複有）

Kinome	
CMGC	52
CAMK	10
AGC	6
CK1	5
STE	4
ATYPICAL	3
TK	5
OTHER	9

InhibitorSelect 386-Well Protein Kinase Inhibitor Library III

標的キナーゼ

Akt	AMPK	ATM
ATR	Aurora	Bcr-Abl
CaMK	Cdks	Cfms
Chk1,2	c-Kit	c-Met
DAG	DNA-PK	EGFR
ERK	FLT3	GSK-3
IGFR	IKK	IRAK
JAK	JNK	Lck
MAPK	MEK	MNK1
p70 S6	PDGFR	PDK1
PI3-K	PKC	PKR
Rho	SK	Src
Syk	TGF-bR	VEGFR

系統別阻害剤数（重複有）

Kinome	
TK	55
CMGC	53
AGC	23
CAMK	10
ATYPICAL	8
LIPID	7
CK1	5
OTHER	18

InhibitorSelect™ 96-Well Tyrosine Kinase and Phosphatase Inhibitor Library IV

標的キナーゼ

Bcr-abl	B-Raf	BTK
CD45	Cdks	cFMSR
c-Met	C-Raf	c-Src
EGFR	ErbB2	ErbB4
FGFR	FGFR3	Flk-1
Flt3	Fyn	Hck
IGF-1R	JAK	JNK
Lck	LYP	Met
mTOR	PDGFR	PDGFR
PI3-K	PKC	Polo mutants
PRL-3	pSTAT3	pSTAT5
PTP1B	Rafs	RET
RTK	Rcn	SHP-1
Src	Syk	Syk mutant
TC PTP	Tie2	TrkA
VEGFR	VEGFR1	VEGFR2
ZAP70 mutant		-

系統別阻害剤数（重複有）

Kinome	
RTK	37
TK	27
TKL	6
AGC	1
CMGC	3
RTP	1
TP	8

CMG : Cdk, MAP, GSK3 and CLK containing Group
CK : Casein Protein Kinases

CAMK : Ca2+/Calmodulin Dependent Protein Kinases
TK : Tyrosine Kinase Group

AGC : PKA, PKG, and PKC Containing Group
STE : Yeast Sterile

阻害剤について

本ライブラリーには DMSO 溶液中で短時間に分解されてしまうもの、沈殿を生じる阻害剤は含まれておりません。全ての阻害剤が細胞透過性なので *in vivo* の分析評価にもお使いいただけます。各阻害剤は単品でも購入可能です。

添付書類について

ライブラリーに含まれる阻害剤についての情報を CD-ROM にまとめてご提供いたします。

- 構造式のデータファイル
- IC_{50} 値
- CAS 番号
- 引用文献
- PubChem Compound ID（リンクつき）
- 阻害剤の説明
- 分子量
- 細胞透過性および ATP 競合情報

製品名	カタログ番号	包装単位	希望販売価格
InhibitorSelect 96-Well Protein Kinase Inhibitor Library I	539744-1EA	1EA	弊社照会
InhibitorSelect 96-Well Protein Kinase Inhibitor Library II	539745-1EA	1EA	弊社照会
InhibitorSelect 96-Well Protein Kinase Inhibitor Library III	539746-1EA	1EA	弊社照会
InhibitorSelect 386-Well Protein Kinase Inhibitor Library III	539743-1EA	1EA	弊社照会
InhibitorSelect™ 96-Well Tyrosine Kinase and Phosphatase Inhibitor Library IV	539747-1EA	1EA	弊社照会

メルクミリポア
阻害剤カタログ 2014

目次

シグナルパスウェイ阻害剤パネルシリーズ 4

阻害剤カクテル・阻害剤セット 7

プロテアーゼ阻害剤カクテル 7
ホスファターゼ 阻害剤カクテル 8
その他 8

新製品 11

プロテアーゼ阻害剤 17

Caplain 阻害剤 17
Collagenase 阻害剤 18
Elastase 阻害剤 18
Furin 阻害剤 18
Matrix Metalloproteinase (MMP) 阻害剤 19
Plasminogen Activator 阻害剤 21
Tissue Inhibitor of Matrix Metalloproteinases (TIMP) 21
プロテアソーム / ユビキチン化阻害剤 21
その他 23

タンパク質リン酸化・脱リン酸化 30

Akt (Protein Kinase B) 阻害剤 30
AMPK 阻害剤 32
Aurora Kinase 阻害剤 32
Calmodulin-Dependent Protein Kinase 阻害剤 31
Casein Kinase (CK) 阻害剤 33
c-Jun N-Terminal Kinase (JNK) 阻害剤 36
Glycogen Synthase Kinase 阻害剤 38
JAK 阻害剤 40
MAP Kinase 阻害剤 41
MEK 阻害剤 44
mTOR 阻害剤 44
Myosin Light Chain Kinase (MLCK) 阻害剤 45
p21 Activated Kinase (PAK) 阻害剤 45
PI 3- キナーゼ 阻害剤 46
Protein Kinase A (PKA) 阻害剤 48
Protein Kinase C (PKC) 阻害剤 49
Protein Kinase G (PKG) 阻害剤 52
Protein Tyrosine Kinase (PTK) 阻害剤 53
Raf Kinase 阻害剤 64
Rho Kinase (ROCK) 阻害剤 64
RNA-Dependant Protein Kinase 阻害剤 65
SHIP 阻害剤 65
STAT 阻害剤 66
TGF-β Receptor Kinase 阻害剤 67
プロテインホスファターゼ 阻害剤 68
その他 73

血管新生阻害剤 74

ATPase/GTPase 77

ATPase 阻害剤 77
GTPase 阻害剤 79

アポトーシス・ネクローシス 80

Autophagy 80
Caspase 阻害剤 80
FTase, GGTase, メチルトランスフェラーゼ 阻害剤 84
Granzyme 阻害剤 85
TNF-α 阻害剤 86
アポトーシス阻害剤 86
アポトーシス誘導剤 87
ネクローシス阻害剤 87
その他 87

Calbiochem®

メルクミリポア
阻害剤カタログ 2014

細胞周期・細胞分裂 88

Checkpoint Kinase 阻害剤 88
Cyclin-Dependent Kinase (Cdk) 阻害剤 90
DNA / RNA Polymerase 阻害剤 93
DNA Methyltransferase 阻害剤 94
Histone Acetylase and Deacetylase 阻害剤 95
Histone Methylation and Demethylation 阻害剤 97
Microtubule Assembly 阻害剤 98
Nuclease 阻害剤 98
p53 阻害剤 98
Peptidylpropyl cis-trans Isomerase 阻害剤 98
Tautomerase 阻害剤 99
Telomerase 阻害剤 99
Topoisomerase 関連 阻害剤 100
細胞接着阻害剤 100
その他 101

細胞増殖・遊走阻害剤 102

DNA 損傷・修復 104

ATM キナーゼ阻害剤 104
DNA-Dependent Protein Kinase 阻害剤 104
MDM2 阻害剤 104

糖タンパク質関連阻害剤 105

GPCR , イオンチャネル 106

Adenyl Cyclase 阻害剤 106
CFTR 阻害剤 108
その他 109

Heat Shock Protein 阻害剤 110

脂質シグナル伝達 111

Acetyl-CoA Carboxylase (ACC) 阻害剤 111
Ceramide kinase 阻害剤 111
Cyclooxygenase (COX) 阻害剤 112
Diacylglycerol (DAG) Kinase 阻害剤 114
HMG-CoA Reductase 阻害剤 114
Lipoxygenase (LOX) 阻害剤 115
Phospholipase 阻害剤 116
Sphingomyelinase 阻害剤 117
その他 118

Mitochondrial Function 阻害剤 120

神経科学・神経変性 121

Amyloidogenesis 阻害剤 121
Secretase 阻害剤 121
その他 123

NF-κB 活性 阻害剤 124

一酸化窒素・酸化ストレス 128

Arginase 阻害剤 128
Guanylate Cyclase 阻害剤 128
Nitric Oxide Synthase (NOS) 阻害剤 128
その他 130

PARP、PARG 阻害剤 131

Phosphodiesterase 阻害剤 132

タンパク質合成 阻害剤 133

幹細胞 135

Sonic Hedgehog Signaling 阻害剤 135
Wnt シグナリング 阻害剤 138
その他 141

ご注文に際して 142
製品名索引（アルファベット順） 143
カタログ番号順索引 164

Calbiochem®

InhibitorSelect™
Signaling Pathway Inhibitor Panel Series



InhibitorSelect Signaling Pathway Inhibitor Panel Series は、シグナルパスウェイごとに、12 ～ 19 種類の阻害剤・アクチベーターなどとしてお使いいただける低分子化合物、溶解用の DMSO、化合物の詳細情報が付いた便利なセットです。

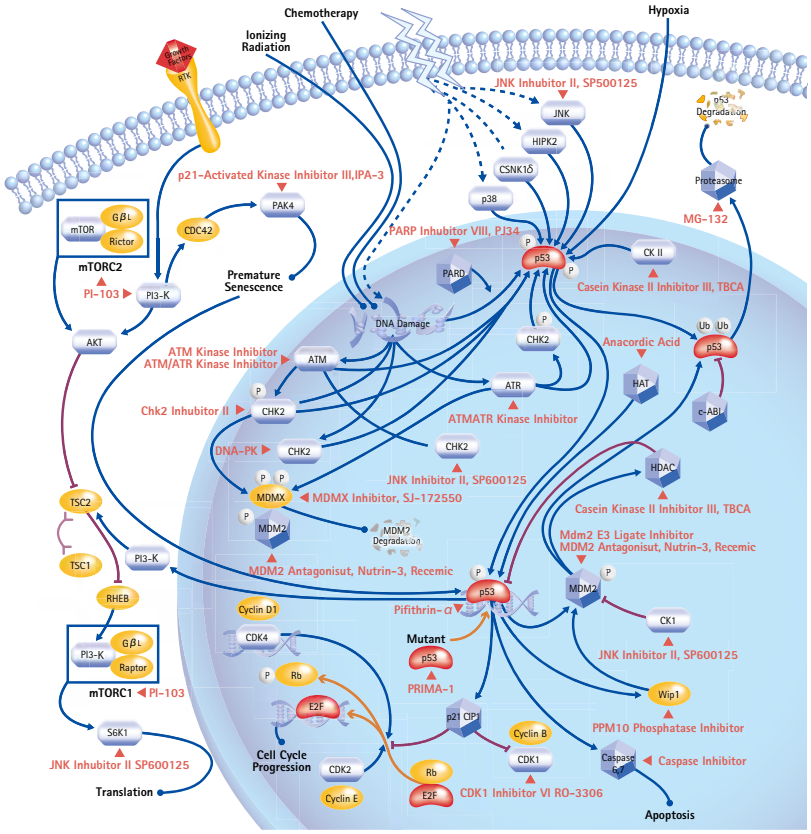
パスウェイごとに関連阻害剤がまとまっているため、ご希望の阻害剤を探すのも、複数の阻害剤の比較をするのも簡単です。

セットに含まれるすべての阻害剤が単品でもご購入いただけますので、スクリーニングにも最適です。p53 と TGF- β R・BMPR シグナルが新たに加わって全 11 種類をラインナップ！

InihibitorSelect p53 Pathway Ragulators Panel では以下の化合物がセットになっています。ご希望の阻害剤を探すなら右下のパスウェイから！

InhibitorSelect™
p53 Pathway Ragulators Panel

コンポーネント
ATM Kinase Inhibitor
ATM/ATR Kinase Inhibitor
Anacardic Acid
Cdk1 Inhibitor IV, RO-3306
Casein Kinase II Inhibitor III, TBCA
Chk2 Inhibitor II
Hdm2 E3 Ligase Inhibitor
JNK Inhibitor II
MDM2 Antagonist, Nutlin-3, Racemic
MDMX Antagonist, SJ-172550
MG-132
p21-Activated Kinase Inhibitor III,IPA-3
Pifithrin-α
PI-103
PARP Inhibitor VIII, PJ34
PPM1D Phosphatase Inhibitor
PRIMA-1
Caspase Inhibitor I
Trichostatin A, *Streptomyces* sp.



各パネルに含まれる阻害剤の詳細はこちらから >>www.merckmillipore.jp/inhibitorselect
その他シグナルパスウェイの情報はこちらから >> www.merckmillipore.jp/pathway

＜主要パスウェイの効率的な解析に＞
シグナルパスウェイ阻害剤パネルシリーズ

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
InhibitorSelect™ Akt/PI3-K/mTOR Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃		124031-1EA	289,900
12 種類の非常に有効性の高い選択的キナーゼと阻害剤 Akt/PI 3-K/mTOR シグナリング経路の研究に役立つ負のコントロールのパネル。このパネルは以下の阻害剤を含みます。Akt 阻害剤 IV（1 mg、製品番号 124011）; Akt 阻害剤 VIII（1 mg)、アイソザイム選択的、Akti-1/2（製品番号 124018）; LY-294002（5 mg、製品番号 440202）; LY 303511（1 mg、製品番号 440203）; PDK1/Akt/Flt2 経路阻害剤（5 mg、製品番号 521275）; PI-103（1 mg、製品番号 528100）; PI 3-Kγ 阻害剤（5 mg、製品番号 528106）; PI 3-Kγ 阻害剤 II（5 mg、製品番号 528108）; PI 3-Kα 阻害剤 IV（5 mg、製品番号 528111）; PI 3-Kα 阻害剤 VIII（5 mg、製品番号 528116）; ラパマイシン（100 µg、製品番号 553210）; Ro-31-8220（500 µg、製品番号 557520）; ウォルトマニン（1 mg、製品番号 681675)。無水 DMSO（製品番号 KP31817）15 ml もご提供いたします。						
InhibitorSelect™ EGFR Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃		324839-1EA	189,900
Akt 阻害剤 VIII（1 mg)、アイソザイム選択的、Akt-1/2（製造番号 124018）; PD 153035（1 mg、製造番号 234490）; EGFR 阻害剤（1 mg、製造番号 324674）; Et-18-OCH3（5 mg、製造番号 341207）; JNK 阻害剤 II（5 mg、製造番号 420119）; LY 294002（5 mg、製品番号 440202）; PD 98059（5 mg、製造番号 513000）; PD 168393（1 mg、製造番号 513033）; PP2（1 mg、製造番号 529573）; ラパマイシン（100 µg、製造番号 553210）; SB 203580（1 mg、製造番号 559389）; AG 490（5 mg、製造番号 658401）ZM 336372（1 mg、製造番号 692000)。無水 DMSO（製品番号 KP31817）15 ml もご提供いたします。						
InhibitorSelect™ FGF Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃		341612-1EA	236,000
FGF によって活性化された複数のシグナリング経路の研究に役立つ、有効な選択的可逆的細胞透過性の阻害剤 14 種類を含むパネル：Akt 阻害剤 VIII（1 mg)、アイソザイム選択的、Akti-1/2（製品番号 124018）; EGF/FGF/PDGF 受容体チロシン・キナーゼ阻害剤（2 mg、製品番号 324841）; ET-18-OCH3（5 mg、製品番号 341207）; FGF/VEGF 受容体チロシン・キナーゼ阻害剤（2 mg)、PD173074（製品番号 341607）; FGF 受容体チロシン・キナーゼ阻害剤（5 mg、製品番号 341608）; Go 6983（500 µg、製品番号 365251）; JNK 阻害剤 VIII（5 mg、製品番号 420135）; LY 294002（5 mg、製品番号 440202）; PD 98059（5mg、製品番号 513000）; PP2（1 mg、製品番号 529573）; Rac1 阻害剤（5 mg、製品番号 553502）; STAT3 阻害剤 III（10 mg)、WP1066（製品番号 573097）; U0126（1 mg、製品番号 662005）; ZM 336372（1 mg、製品番号 692000)。無水 DMSO（製品番号 KP31817）15 ml もご提供いたします。						
InhibitorSelect™ IGF Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃		407249-1EA	249,000
IGF によって活性された複数のシグナリング経路の研究に役立つ、有効な選択的可逆的細胞透過性阻害剤を 13 種類と、有効な選択的可逆的阻害剤 1 種類と、有効な選択的不可逆的細胞透過性阻害剤を 1 種類を含んだパネル：AG1024（1 mg、製品番号 121767）; Akt 阻害剤 IV（1 mg 、製品番号 124011）; Akt 阻害剤 VIII（1 mg)、アイソザイム選択的、Akti-1/2（製品番号 124018）; AMPK 阻害剤（1 mg)、化合物 C（製品番号 171260）; BpVphen（10 mg 、製品番号 203695）; ERK 阻害剤（1 mg)、FR180204（製品番号 328007）; GSK-3β 阻害剤 VIII（5 mg、製品番号 361549）; IGF-1R 阻害剤（1 mg)、PPP（製品番号 407247）; NBI-31772（5 mg 、製品番号 479830）; PD 98059（5 mg、製品番号 513000）; PI-103（1 mg、製品番号 528100）; PKCβ 阻害剤（500 µg、(製品番号 539654）; ラパマイシン（100 µg、製品番号 553210）; RSK 阻害剤（1 mg)、SL0101（製品番号 559285）; ZM 336372（1 mg、製品番号 692000)。無水 DMSO（製品番号 KP31817）15 ml もご提供いたします。						
InhibitorSelect™ JAK/STAT Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃		420138-1EA	179,900
JAK/STAT シグナリング経路の研究に役立つ 13 種類の有効で選択的な阻害剤を含む便利なパネル。このパネルは以下の阻害剤を含みます。インジルビン誘導体 E804（1 mg、製品番号 402081）; JAK 阻害剤 I（500 µg、製品番号 420099）; JAK2 阻害剤 II（25 mg、製品番号 420132）; LY 294002（5 mg、製品番号 440202）; PD 153035（1 mg、製品番号 234490）; PP2（1 mg、製品番号 529573）; SHP1/2 PTPase 阻害剤（50 mg)、NSC-87877（製品番号 565851）; STAT3 阻害剤 Peptide（1 mg)、細胞透過性（製品番号 573096）; STAT3 阻害剤 III（10 mg)、WP1066（製品番号 573097）; STAT3 阻害剤 V（25 mg)、Stattic（製品番号 573099）; STAT5 阻害剤（10 mg、製品番号 573108）; AG490（5 mg、製品番号 658401）U0126（1 mg、製品番号 662005)。無水 DMSO（製品番号 KP31817）15 ml もご提供いたします。						
InhibitorSelect™ MAP Kinase Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃		444189-1EA	235,000
MAP キナーゼシグナリング経路の研究に役立つ 12 種類の有効な選択的阻害剤のパネル。このパネルは以下の阻害剤を含みます。ERK 阻害剤 II、FR180204（1 mg、製品番号 328007）; JNK 阻害剤 II（5 mg、製品番号 420119）; JNK 阻害剤 IX（5 mg、製品番号 420136）; MEK1/2 阻害剤（1 mg、製品番号 444939）; MNK1 阻害剤（5 mg、製品番号 454861）; MK2a 阻害剤（5 mg、製品番号 475863）; p38 MAP キナーゼ 阻害剤 V（1 mg、製品番号 506156）; PD 98059（5 mg、製品番号 513000）; Raf キナーゼ 阻害剤 IV（1 mg、製品番号 553014）; SB 203580（1 mg、製品番号 559389）; Tpl2 キナーゼ 阻害剤（1 mg、製品番号 616373）ZM 336372（1 mg、製品番号 692000)。無水 DMSO（製品番号 KP31817）15ml もご提供いたします。						
InhibitorSelect™ NF-κB Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃		481487-1EA	225,900
NF-κB シグナリング経路の研究に役立つ 14 種類の有効で選択的な阻害剤を含むパネル。このパネルは以下の阻害剤を含みます。BAY 11-7082（10 mg、製品番号 196870）; IKK 阻害剤 VII（1 mg、製品番号 401486）; インターロイキン 1- 受容体関連キナーゼ -1/4 阻害剤（5 mg、製品番号 407601）; ヒストンアセチルトランスフェラーゼ阻害剤 II（10 mg、製品番号 382110）; MG-132（5 mg、製品番号 474790）; NEMO- 結合ドメイン結合ペプチド、細胞透過性（500 µg、製品番号 480025）; NF-κB SN50、細胞透過性阻害剤 Peptide（500 µg、製品番号 481480）; PD 98059（5 mg、製品番号 513000）; PDK1/Akt/Flt 2 経路阻害剤 5 mg、(製品番号 521275）; トリコスタチン A、ストレプトマイセス sp.（1 mg、製品番号 647925）; TIRAP 阻害剤 Peptide、Cell-Permeable（1 mg、製品番号 613570)、Tpl2 Kinase 阻害剤（1 mg、製品番号 616373)、（5Z）-7-Oxozeaenol、Curvularia（製品番号 499610）（1 mg、製品番号 499610）JNK 阻害剤 II（5 mg、製品番号 420119)。無水 DMSO（製品番号 KP31817）15 ml もご提供いたします。						
InhibitorSelect™ VEGF Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃		676502-1EA	249,000
VEGF によって活性化された複数のシグナリング経路の研究に役立つ、有効な選択的可逆的細胞透過性の阻害剤 15 種類を含むパネル：Akt 阻害剤 VIII（1 mg)、アイソザイム選択的、Akti-1/2（製品番号 124018）; カルシニューリン Calcineurin 自己阻害剤ペプチド（1 mg)、細胞透過性（製品番号 207001）; ET-18-OCH3（5 mg、製品番号 341207）; Go 6983（500 µg、製品番号 365251）; NG - ニトロ -L- アルギニンメチルエステル（100 mg)、塩酸塩（製品番号 483125）; p21- 活性キナーゼ阻害剤 III（5 mg)、IPA-3（製品番号 506106）; cPLA2α 阻害剤（500 µg、製品番号 525143）; PI-103（1 mg、製品番号 528100）; PP2（1 mg、製品番号 529573）; SB 203580（1 mg、製品番号 559389）; U0126（1 mg、製品番号 662005）; VEGFR チロシンキナーゼ阻害剤 V（5 mg、製品番号 676501)、VEGFR2 キナーゼ阻害剤 VI、Ki8751（5 mg、製品番号 676484）; VEGFR2 キナーゼ阻害剤 III、SU5416（1 mg、製品番号 676487）; ZM 336372（1 mg、製品番号 692000)。無水 DMSO（製品番号 KP31817）15 ml、データシートもご提供いたします。						

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
InhibitorSelect™ Wnt Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃	DMSO（supplied）. Please refer to information provided on the CD for reconstitution information of individual inhibitors.	681666-1EA	205,000
Wnt シグナル伝達経路の研究に役立つ強力な選択的阻害剤 15 種類のセット。以下の阻害剤を含みます：1 mg Casein Kinase IInhibitor、D4476（製品番号 218696）；5 mg Casein Kinase II Inhibitor II、DMAT（製品番号 218699）；10 mg β-Catenin/Tcf Inhibitor、FH535（製品番号 219330）；1 mg GSK-3 Inhibitor IX（製品番号 361550）；1 mg PKG Iα Inhibitor、Cell-Permeable（製品番号 370655）；1 mg H-89、Dihydrochloride（製品番号 371963）；100 µg K-252a、*Nocardiopsis* sp.（製品番号 420298）；5 mg JNK InhibitorII（製品番号 420119）；1 mg KN-93（製品番号 422708）；5 mg LY 294002（製品番号 440202）；1 mg（5Z）-7-Oxozeaenol、Curvularia（製品番号 499610）；1 mg PP2（製品番号 529573）；100 µg Rapamycin（製品番号 553210）；1 mg SB 202190（製品番号 559388）；1 mg U0126（製品番号 662005）。無水 DMSO（製品番号 KP31817）15 ml も同梱されています。						
InhibitorSelect™ p53 Pathway Ragulators Panel				-20℃		506169-1EA	392,000
p53 パスウェイ研究用に役立つ 18 種類の選択的かつ細胞透過性阻害剤および 1 種類のアクチベーターのセットです。ATM Kinase Inhibitor（製品番号 118500）2 mg、ATM/ATR Kinase Inhinitor（製品番号 118501）5 mg、Anacardic Acid（製品番号 172050）10 mg、Cdk1Inhibitor IV（製品番号 217699）5 mg、Casein Kinase II Inhibitor III（製品番号 218710）5 mg、Chk2 Inhibitor II（製品番号 220486）1 mg、Hdm2 E3 Ligase Inhibitor（製品番号 373225）5 mg、JNK Inhibitor II（製品番号 420119）5 mg、MDM2 Antagonist、Nutin-3, Racemic（製品番号 444143）1 mg、MDMX Inhibitor（製品番号 444155）10 mg、MG-132（製品番号 474790）5 mg、p21-Activated Kinase Inhibitor III（製品番号 506106）5 mg、Pifithrin-α（製品番号 506132）5 mg、PI-103（製品番号 528100）1 mg、PARP Inhibitor VIII（製品番号 528150）1 mg、PPM1D Phosphatase Inhibitor（製品番号 529578）10 mg、PRIMA-1（製品番号 530050）10 mg、Caspase Inhibitor I（製品番号 627610）1 mg、Trichostatin A、*Streptomyces sp.*（製品番号 647925）無水 DMSO（製品番号 KP31817）						
InhibitorSelect™ TGF-βR and BMPR Signaling Pathway Inhibitor Panel				-20℃		616466-1EA	287,000
TGF-βR と BPMR シグナルパスウェイ研究用に役立つ 18 種類の選択的かつ細胞透過性阻害剤のセットです。Akt Inhibitor XIII（製品番号 124030）2 mg、Dorsomorphin（製品番号 171260）1 mg、ET-18-OCH3（製品番号 124030）5 mg、IRAK-1/4 Inhibitor（製品番号 407601）5 mg、JAK Inhibitor I（製品番号 420099）500 µg、MG-132（製品番号 474790）5 mg、（5Z）-7- Oxozeaenol, *Curvularia sp.*（製品番号 499610）1 mg、p21-Activated Kinase Inhibitor II（製品番号 506106）5 mg、PD169316（製品番号 513030）1 mg、PI-103（製品番号 528100）1 mg、Rac1 Inhibitor（製品番号 553502）5 mg、Ro-31-8220（製品番号 557520）500 µ;g Smad3 Inhibitor（製品番号 566405）1 mg、STAT3 Inhibitor III、WP1066（製品番号 573097）10 mg、TGF-βRI Kinase Inhibitor II（製品番号 616452）1 mg、TGF-βRI Kinase Inhibitor VI（製品番号 616461）5 mg、U0126（製品番号 662005）1 mg、Y-27632（製品番号 688000）1 mg、無水 DMSO						

阻害剤カクテル・阻害剤セット

プロテアーゼ阻害剤カクテル

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
FOCUS-Protease Arrest™ Cocktail				+4℃		344045-1ML	45,000
二次元ゲルサンプル調製専用に開発されたプロテアーゼカクテル。動物組織、植物、酵母および細菌に由来するセリン、システイン、メタロプロテイナーゼ、およびカルパインプロテアーゼを阻害します。本品には EDTA を使用していないので、サンプルからの核酸の除去は、FOCUS-Nuclease を使用して下さい。抽出バッファー（pH 7.0-8.0）中で 1 x 濃度の FOCUS-Protease Arrest を使用すると、プロテアーゼ活性を 95-98%阻害できます。							
Protease Inhibitor Cocktail Set III, Animal-Free				-20℃		535140-1ML	15,900
						535140-1SET	64,900
アスパラギン酸プロテアーゼ、システインプロテアーゼ、セリンプロテアーゼ、およびアミノペプチダーゼの阻害に広い特異性を示す 6 種類のプロテアーゼ阻害剤のカクテルです。本カクテルは、哺乳類細胞および組織抽出液への使用に適しています。Note: 1 ml バイアルまたは 5 x 1 ml のセットがあります。各バイアルには、100 mM AEBSF、HCl（製品番号 101500）、80 µM Aprotinin（製品番号 616371）、5 mM Bestatin（製品番号 200484）、1.5 mM E-64（製品番号 324890）、2 mM Leupeptin Hemisulfate（製品番号 108975）および 1 mM Pepstatin A（製品番号 516481）が含まれています。							
Protease Inhibitor Cocktail Set V, Animal-Free				-20℃		535141-1ML	15,000
						535141-1SET	53,000
4 種類のプロテアーゼ阻害剤のカクテル。セリンプロテアーゼおよびシステインプロテアーゼを阻害しますが、メタロプロテアーゼは阻害しません。各バイアルを 1 ml の H_2O に溶解すると 100 倍原液となります。1 倍液には、500 µM AEBSF、HCl（製品番号 101500）、150 nM Aprotinin（製品番号 616371）、1 µM E-64（製品番号 324890）、および 1 µM Leupeptin Hemisulfate（製品番号 108975）が含まれています。バイアル 1 本から 1 ml の 100 倍原液ができます。							
Protease Inhibitor Cocktail Set I, Animal-Free				-20℃	Reconstitute each vial in 1 ml H_2O to yield a 100X stock solution.	535142-1ML	8,900
						535142-1SET	53,000
Protease Inhibitor Cocktail Set I（製品番号 539131）の動物原料フリータイプ。リコンビナントのアプロチニンを使用しています。1 ml の H_2O に溶解すると 100X ストック溶液となります。1x 溶液の内容：500 µM AEBSF、HCl（製品番号 101500）、150 nM Aprotinin（製品番号 616371）、1 µM E-64（製品番号 324890）、0.5 mM EDTA、Disodium Salt、1 µM Leupeptin Hemisulfate（製品番号 108975）。 1 ml 入りと 1 ml x10 本入りがあります。							
Protease Arrest™ Reagent				+4℃		539124-1SET	43,000
セリン、システインおよびカルパインプロテアーゼを阻害する様々な可逆的および不可逆的阻害物質を最適濃度で含む溶液です。動物組織、植物組織、酵母および細菌より精製したタンパク質の保護に適しています。メタロプロテイナーゼ阻害用の EDTA も別添しています。本品は 50 倍濃縮液です。これを抽出バッファーで希釈すると（pH7.0 - 8.0）、プロテアーゼ活性の 95 - 98% が阻害されます。							
Protease Inhibitor Set				-20℃		539128-1SET	73,000
内容：AEBSF、HCl（製品番号 101500）50 mg、E-64（製品番号 324890）1 mg、EST（E-64d; 製品番号 330005）1 mg、Leupeptin、Hemisulfate（製品番号 108975）5 mg、Pepstatin A 5 mg、TLCK、HCl（製品番号 616382）50 mg および TPCK（製品番号 616387）250 mg。							
Protease Inhibitor Cocktail Set VIII				+4℃		539129-1ML	18,900
						539129-1SET	73,000
カルパイン、カテプシン、パパインなどのシステインプロテアーゼの阻害に高い特異性を示す 3 種類のプロテアーゼ阻害剤のカクテルです。各バイアルには、1.56 mM ALLN（製品番号 208719）、1.5 mM E64 Protease（製品番号 324890）、および 0.5 mM Cathepsin Inhibitor I（製品番号 219415）が含まれています。							
Protease Inhibitor Cocktail Set I				-20℃	Reconstitute each vial with 1 ml H_2O to yield a 100X stock solution.	539131-1VL	7,900
						539131-10VL	46,900
多様なプロテアーゼを阻害する 5 種類のプロテアーゼ阻害物質の混合溶液。							
Protease Inhibitor Cocktail Set II				-20℃	This product is provided as a lyophilized solid, ready for reconstitution. For the researcher's convenience, this protease inhibitor cocktail is provided as either a single vial plus one vial of 1.0 ml DMSO or as a set of 5 vials plus 5 vials of 1.0 ml DM	539132-1SET	18,900
						539132-5SET	58,000
アスパラギン酸、システイン、セリンプロテアーゼ、メタロプロテアーゼ、およびアミノペプチダーゼを阻害する広域特異性を有する 5 種類のプロテアーゼ阻害物質の混合溶液。本品は細菌細胞抽出物への使用を推奨します。							
Protease Inhibitor Cocktail Set VI				-20℃		539133-1ML	17,900
						539133-1SET	71,000
アスパラギン酸、システイン、セリンおよびメタロプロテアーゼ、ならびにアミノペプチダーゼを阻害する特異性の広い 6 種類のプロテアーゼ阻害剤を混合したものです。							
Protease Inhibitor Cocktail Set III				-20℃		539134-1ML	12,000
						539134-1SET	54,000
アスパラギン酸、システインおよびセリンプロテアーゼおよびアミノペプチダーゼを阻害する広域特異性の 6 種類のプロテアーゼ阻害物質の混合溶液。本品は哺乳類細胞および組織抽出物への適用を推奨します。							
Protease Inhibitor Cocktail Set IV				-20℃		539136-1ML	14,900
						539136-1SET	47,000
アスパラギン酸およびシステインプロテアーゼ、メタロプロテアーゼ、およびセリンプロテアーゼを阻害する広域特異性プロテアーゼ阻害物質 4 種類の混合溶液。本品は真菌および酵母抽出物への使用を推奨します。Each vial contains 100 mM AEBSF、HCl（製品番号 101500）、1.5 mM E-64（製品番号 324890）、2 mM Pepstatin A、and 500 mM 1、10-Phenanthroline（製品番号 516705）。							
Protease Inhibitor Cocktail Set V, EDTA-Free				-20℃	Reconstitute each vial with 1 ml H_2O to obtain a 100X stock solution.	539137-1ML	8,900
セリンプロテアーゼおよびシステインプロテアーゼを阻害する 4 種類のプロテアーゼ阻害剤のカクテルです。メタロプロテアーゼには阻害作用を示しません。							

阻害剤カクテル・阻害剤セット

プロテアーゼ阻害剤カクテル

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Protease Inhibitor Cocktail Set VII				-20℃		539138-1ML	15,900
						539138-1SET	49,000
システイン、セリン、アスパラギン酸およびサーモリシン様プロテアーゼ、ならびにアミノペプチダーゼを阻害する特異性の広い 5 つのプロテアーゼ阻害剤を混合したもの。この混合液は His タグ融合タンパク質の精製に推奨されます。							
Serine Protease Inhibitor Cocktail Set I				-20℃	Reconstitute with 1 ml H_2O to yield a 100X stock solution.	565000-1VL	16,000
						565000-5VL	63,000
幅広いセリンプロテアーゼを阻害する 4 種類のプロテアーゼ阻害物質のカクテルです。							

ホスファターゼ 阻害剤カクテル

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set II				-20℃		524625-1SET	54,900
タンパク質チロシンホスファターゼ（PTP）や酸ホスファターゼ、アルカリホスファターゼの阻害のための 5 種類のホスフォターゼ阻害剤の混合物。洗浄液含有のサンプルを含む細胞溶解物と組織抽出物と使用するのに適しています。以下の構成物を含む 1 ml バイアル 5 つセットでご提供いたしております。イミダゾール（200 mM）、フッ化ナトリウム（100 mM）、モリブデン酸ナトリウム（115 mM）、オルトバナジウム酸ナトリウム（100 mM）Sodium Tartrate Dihydrate（400 mM）。							
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set III				-20℃		524627-1ML	28,900
						524627-1SET	95,900
セリン／スレオニンならびにタンパク質チロシンホスフォターゼの両方の広範囲の阻害のためのホスフォターゼ阻害剤 4 種類の混合物。1 ml バイアルひとつまたは 1 ml バイアル 5 つのセットがあります。各バイアルには次の構成物と水溶液 1 ml が含まれています。50 mM フッ化ナトリウム、10 mM β- グリセロリン酸（製品番号 35675）、10 mM ピロリン酸ナトリウム十水和物、1 mM オルトバナジウム酸ナトリウム。							
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set IV				-20℃		524628-1ML	19,900
						524628-1SET	70,000
セリン／スレオニンならびにアルカリホスフォターゼの両方の阻害のためのホスフォターゼ阻害剤 3 種類の混合物。1 ml バイアルひとつまたは 1 ml バイアル 5 つのセットがあります。各バイアルには次の構成物と水溶液 1 ml が含まれています。500 µM カンタリジン（製品番号 210155）、2.5 mM (-) -p-Bromotetramisole シュウ酸塩、1 µM カリクリン A、Discodermia calyx（製品番号 208851）。							
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set V				-20℃		524629-1ML	30,900
						524629-1SET	95,000
セリン／スレオニンならびにタンパク質ホスフォターゼの両方の阻害のためのホスフォターゼ阻害剤 4 種類の混合物。1 ml バイアルひとつまたは 1 ml バイアル 5 つのセットがあります。各バイアルには次の構成物と水溶液 1 ml が含まれています。250 mM フッ化ナトリウム、50 mM β グリセロリン酸エステル（製品番号 35675）、50 mM ピロリン酸ナトリウム十水和物、50 mM オルトバナジウム酸ナトリウム。							
Protein Phosphatase Inhibitor Set II				-20℃		539630-1SET	82,000
セット内容：Cypermethrin（製品番号 239900）10 mg、Dephostatin（製品番号 263200）1 mg、Okadaic Acid（製品番号 495604）10 µg。および NIPP-1、Bovine Thymus 1 µg。							
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set V, 50X, Lyophilized				+4℃	H_2O	524632-1SET	74,000
						524632-1ML	22,000

その他

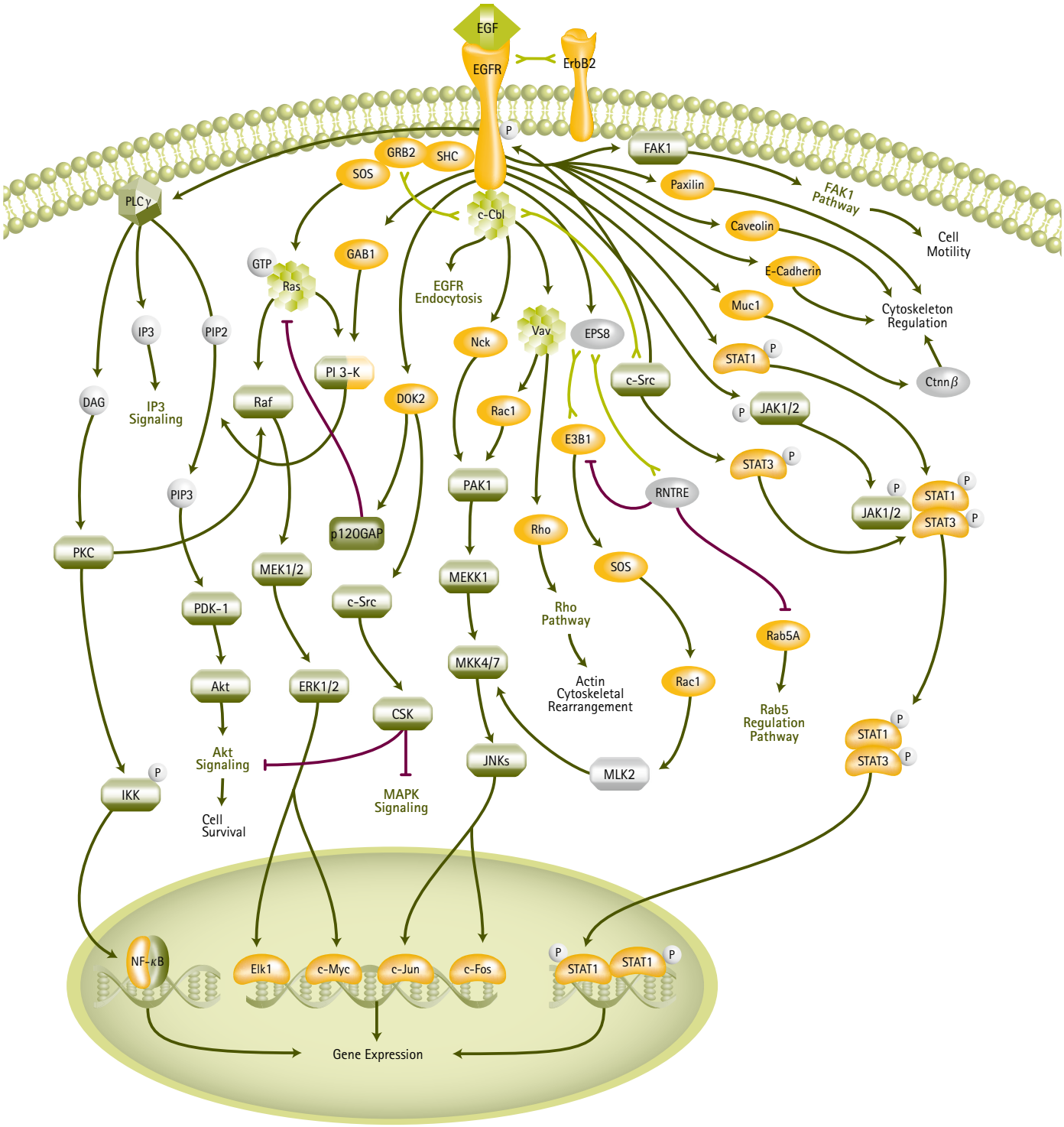
	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Calpain Inhibitor Set				-20℃		208733-1SET	92,900
5 mg of ALLN（製品番号 208719）、25 mg of Calpain Inhibitor III（製品番号 208722）、5 mg of Calpeptin（製品番号 03-34-0051）、1 mg of EST（製品番号 330005）、5 mg of PD 150606（製品番号 513022）の 5 つの阻害剤が含まれます。							
Caspase Inhibitor Set II				-20℃		218772-1SET	98,000
下記阻害剤が 250 µg ずつ含まれます。Caspase-1 Inhibitor VI、Z-YVAD-FMK（製品番号 218746）；Caspase-2 Inhibitor I、Z-VDVAD-FMK（製品番号 218744）；Caspase-3 Inhibitor II、Z-DEVD-FMK（製品番号 264155）；Caspase-5 Inhibitor I、Z-WEHD-FMK（製品番号 218753）；Caspase-6 Inhibitor I、Z-VEID-FMK（製品番号 218757）；Caspase-8 Inhibitor II、Z-IETD-FMK（製品番号 218759）；Caspase-9 Inhibitor I、Z-LEHD-FMK（製品番号 218761）；Caspase Inhibitor III、Boc-D-FMK（製品番号 218745）。							
Caspase Inhibitor Set III				-20℃		218806-1SET	145,900
カスパーゼファミリーに属する様々なプロテアーゼに対する ready-to-use の不可逆的阻害剤セットです。下記阻害剤が 25 µl（2 mM）ずつ含まれます。Caspase-1 Inhibitor VI、Z-YVAD-FMK（製品番号 218746）；Caspase-2 Inhibitor I、Z-VDVAD-FMK（製品番号 218744）；Caspase-3 Inhibitor II、Z-DEVD-FMK（製品番号 264155）；Caspase-5 Inhibitor I、Z-WEHD-FMK（製品番号 218753）；Caspase-6 Inhibitor I、Z-VEID-FMK（製品番号 218757）；Caspase-8 Inhibitor II、Z-IETD-FMK（製品番号 218759）；Caspase-9 Inhibitor I、Z-LEHD-FMK（製品番号 218761）；Caspase Inhibitor I、Z-VAD-FMK（製品番号 627610）。							
Caspase Inhibitor Set IV				-20℃		218825-1SET	92,000
カスパーゼ阻害試験に使用する 5 種類の ready-to-use の試薬とアポトーシス誘導因子のセットです。Z-DEVD-FMK（製品番号 264155）；Z-IETD-FMK（製品番号 218759）；Z-LEHD-FMK（製品番号 218761）；Z-VAD-FMK（製品番号 627610）；the negative control Z-FA-FMK（製品番号 342000）、aqueous solution（100 µl、6.1 µg/µl）of an apoptosis inducer、Doxorubicin、Hydrochloride（製品番号 324380）。各記阻害剤が 10 mM DMSO 溶液として 2 µl ずつ含まれます。							
Cyclin-Dependent Protein Kinase Inhibitor Set				-20℃		219428-1SET	43,900
Olomoucine（製品番号 495620）5 mg、Iso-Olomoucine（製品番号 495622）1 mg、Roscovitine（製品番号 557360）1 mg が含まれます。							
Caspase Inhibitor Set I				-20℃		235429-1SET	103,000
セット内容は以下の通りです。1 mg of Caspase-3 Inhibitor II、Z-DEVD-FMK（製品番号 264155）；1 mg of Caspase-1 Inhibitor I、Ac-YVAD-CHO（製品番号 400010）；1 mg of Caspase Inhibitor I、Z-VAD-FMK（製品番号 627610）。							

阻害剤カクテル・阻害剤セット

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Cyclooxygenase Inhibitor Set				-20℃		239783-1SET	82,900
以下の阻害剤が含まれます : Meloxicam（製品番号 444800）100 mg、NS-398（製品番号 349254）5 mg、SC-560（製品番号 565610）5 mg、Sulindac Sulfide（製品番号 574102）5 mg。							
MMP Inhibitor Set I				-20℃		444255-1SET	92,000
本セットには、MMP-2/MMP-9 Inhibitor I（製品番号 444241）および MMP-3 Inhibitor II（製品番号 444225）が各 5 mg、GM 6001（製品番号 364205）、GM 6001、negative control（製品番号 364210）および MMP-8 Inhibitor I（製品番号 444237）が各 1 mg が含まれています。							
MEK Inhibitor Set				-20℃		453710-1SET	48,900
本セットには、PD 98059（製品番号 513000）5 mg、U0126（製品番号 662005）1 mg および U0124（製品番号 662006；ネガティブコントロール）1 mg が含まれています。							
Protein Kinase Inhibitor Set				-20℃		476490-1SET	87,000
セット内容 : Ro-31-8220（製品番号 557520）500 µg、Genistein（製品番号 345834）20 mg、KN-93、Water-Soluble（製品番号 422711）1 mg、KT5720（製品番号 420320）50 µg、Staurosporine、*Streptomyces* sp. 100 µg および U0126（製品番号 662005）1 mg。製品説明書も付属しています。							
Phosphodiesterase Inhibitor Set I					See properties table for specific solvent and recommended stock concentration.	524718-1SET	95,000
（PDE Inhibitor Set）	セット内容：8-Methoxymethyl-3-isobutyl-1-methylxanthine [製品番号 454202、Ca^{2+}/CaM 依存性 PDE（PDE I）阻害剤]10 mg、4-{[3′、4′-(Methylenedioxy) benzyl]amino}-6-methoxyquinazoline [製品番号 475250、cGMP 特異性 PDE（PDE V）阻害剤] 1 mg、Rolipram [製品番号 557330、cAMP- 特異性 PDE（PDE IV）阻害剤] 5 mg、および Trequinsin、Hydrochloride [製品番号 382425、cGMP- 阻害性 PDE（PDE III）阻害剤]]10 mg。製品説明書も付属しています。							
PARP Inhibitor Set				-20℃		528820-1SET	65,000
100 mg の 3-Aminobenzamide（製品番号 165350）、各 5 mg の 5-Iodo-6-Amino-1, 2-Benzopyrone（製品番号 407850）、1, 5-Isoquinolinediol（製品番号 419800）および NU 1025（製品番号 493800）、および 1 mg の DPQ（製品番号 300270）をセットにしたもの。製品説明書も付属しています。							
Proteasome Inhibitor Set I				-20℃		539164-1SET	81,900
Proteasome Inhibitor I（製品番号 539160）1 mg、Lactacystin（製品番号 426100）200 µg、および MG-132（製品番号 474790）1 mg のセットです。製品説明書も付属しています。							
Proteasome Inhibitor Set II				-20℃		539165-1SET	86,900
ALLN（製品番号 208719）5 mg、Epoxomicin（製品番号 324800）および clasto-Lactacystin β-Lactone（製品番号 426102）各 100 µg のセットです。製品説明書も付属しています。							
Protein Kinase C Inhibitor Set				-20℃	These inhibitors are soluble in DMSO	539573-1SET	96,900
（Protein Kinase C Inhibitor Set）	キットの内容は、Bisindolylmaleimide I（製品番号 203290）250 µg、Calphostin C、*Cladosporium cladosporioides*（製品番号 208725）50 µg、Chelerythrine Chloride（製品番号 220285）5 mg、Go6976（製品番号 365250）500 µg、Myristoylated Protein Kinase C Inhibitor 20-28、Cell-Permeable（製品番号 476480）500 µg、および Ro-32-0432（製品番号 557525）500 µg です。取扱説明書も付属しています。						
Src Family Protein Tyrosine Kinase Inhibitor Set				-20℃		567816-1SET	73,000
本セットには、20 mg の Genistein（製品番号 345834）、100 µg の Herbimycin A 、*Streptomyces* sp.（製品番号 375670）、および各 1 mg の PP2（製品番号 529573）および PP3（製品番号 529574）が含まれています。製品解説書も付属しています。							
Tyrosine Kinase Inhibitor Set II				-20℃	Concentrated solutions of ≥ 1 mg/ml should be prepared in anhydrous DMSO.	657021-1SET	71,000
本セットには、20 mg の Genistein（製品番号 345834）、1 mg の PP2（製品番号 529573）、5 mg の AG 490（製品番号 658401）、5 mg の AG 1296（製品番号 658551）および 5 mg AG 1478（製品番号 658552）が含まれています。製品説明書も付属しています。							
MAP Kinase Inhibitor Set I				-20℃	These inhibitors are soluble in DMSO.	444180-1SET	77,000
本セットには、MEK inhibitor PD 98059（製品番号 513000）5 mg、MAP kinase inhibitor SB 202190（製品番号 559388）および SB 203580（製品番号 559389）が各 1 mg、および SB 202474（製品番号 559387；ネガティブコントロール）1 mg が含まれています。製品説明書も付属しています。							
MAP Kinase Cascade Inhibitor Set				-20℃		444185-1SET	78,000
本セットには、FPT Inhibitor III（製品番号 344154）および ZM 336372（製品番号 692000）が各 1 mg、PD 98059（製品番号 513000）5 mg および SB 203580（製品番号 559389）1 mg が含まれています。製品説明書も付属しています。							
MAP Kinase Inhibitor Set II				-20℃		444190-1SET	69,000
本セットには、PD 98059（製品番号 513000）5 mg、SB 203580（製品番号 559389）および U0126（製品番号 662005）が各 1 mg、および SB 202474（製品番号 559387；ネガティブコントロール）1 mg が含まれています。製品説明書も付属しています。							

EGF Pathway


EGF
EGFR
ErbB2
P
GRB2
SHC
SOS
PLCγ
c-Cbl
FAK1
Paxilin
FAK1 Pathway
Cell Motility
Caveolin
E-Cadherin
Muc1
Cytoskeleton Regulation
Ctnnβ
GTP
Ras
GAB1
EGFR Endocytosis
Vav
EPS8
Nck
STAT1
c-Src
IP3
PIP2
PI 3-K
DAG
IP3 Signaling
Raf
DOK2
Rac1
JAK1/2
E3B1
STAT3
PIP3
PAK1
RNTRE
p120GAP
Rho
SOS
MEK1/2
MEKK1
c-Src
Rho Pathway
Rab5A
PKC
PDK-1
MKK4/7
Rac1
Actin Cytoskeletal Rearrangement
Rab5 Regulation Pathway
Akt
ERK1/2
CSK
Akt Signaling
JNKs
MLK2
IKK
MAPK Signaling
Cell Survival
NF-κB
Elk1
c-Myc
c-Jun
c-Fos
Gene Expression

新製品

Activators

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Akt Activator II, SC79	25 MG	123871-25MG	34,900
AMPK Signaling Activator XIII, ZLN005	25 MG	5.04377.0001	42,000
ApoE4 Modulator, PH002	10 MG	178477-10MG	28,900
ATIC Dimerization Inhibitor	10 MG	118490-10MG	28,000
Bexarotene	50 MG	200499-50MG	16,000
CFTR Activator, Cact-A1	10 MG	5.05985.0001	37,000
Cryptocrome Activator, KL001	25 MG	233624-25MG	40,000
Cuspin-1	25 MG	5.04906.0001	37,000
EIF2AK3 Activator, CCT020312	5 MG	324879-5MG	40,000
Forskolin, Coleus forskohlii in DMSO	5 MG	344282-5MG	13,000
FPRL1 Agonist II, C43	10 MG	344149-10MG	39,000
GPR40 Agonist II	10 MG	371721-10MG	22,000
GPR81 Agonist, 3Cl-5OH-BA	100 MG	371758-100MG	22,000
Herg Activator, NS1643	10 MG	373501-10MG	16,000
Hsp70 Activator, YM-1	10 MG	5.00615.0001	42,000
IRTK Activator III, DDN	25 MG	420326-25MG	19,000
Leukadherin-1	25 MG	434610-25MG	28,900
Nrf2 Activator II, AI-1	25 MG	492041-25MG	40,000
Nrf2 Activator III, TAT-14 Peptide	10 MG	492042-10MG	61,000
Nur77 LBD Antagonist, TMPA	10 MG	492910-10MG	35,000
PKM2 Activator II, DASA	10 MG	550602-10MG	28,900
PKM2 Activator III	10 MG	5.04537.0001	42,000
PON1 Activator, ZNPA	10 MG	529505-10MG	22,000
PPARg Modulator, SR1664	2 MG	516570-2MG	29,000
Pyruvate Kinase Activator	25 MG	550601-25MG	33,900
RubR1 Activator, GF-15	25 MG	5.00495.0001	42,000
TMEM16A Activator, Eact	10 MG	613550-10MG	48,900

Agonists

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
7a, 25-dihydroxycholesterol	1 MG	128136-1MG	36,000
ACEA	5 MG	5.04191.0001	11,000
AhR Agonist V, VAF347	10 MG	182690-10MG	38,900
AMPA Agonist, CMPA	5 MG	155306-5MG	20,000
CXCR3 Agonist, PS372424	5 MG	239823-5MG	22,000
CXCR4 Antagonist III	10 MG	239822-10MG	28,900
CXCR7 Agonist, VUF11207	10 MG	239824-10MG	28,000
GTS-21 Dihydrochloride (DMBX-A)	10 MG	5.05277.0001	17,000
L-(+)-2-Amino-4-phosphonobutyric Acid	1 MG	165300-1MG	39,000
PNU 282987	10 MG	5.05278.0001	24,000
REV-ERB Agonist II, SR9009	25 MG	554726-25MG	28,900
RORα/γ Agonist, SR1078	10 MG	557352-10MG	38,900
Rosiglitazone	10 MG	557366-10MG	19,000
S1P1 Receptor Agonist III	10 MG	567734-10MG	16,000
TRPML Agonist, ML-SA1	25 MG	648493-25MG	28,900
Wnt Agonist II, SKL2001	25 MG	681667-25MG	48,900
ZK-756326	10 MG	5.04374.0001	26,000

Antagonists

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
(+)-Tubocurarine Chloride	10 MG	5.05145.0001	6,000
Adenosine A2A Receptor Antagonist II SCH58261	10 MG	119150-10MG	38,000
Adenosine A2A/A1 Receptor Antagonist	10 MG	116765-10MG	25,000
Adenosine A3 Receptor Antagonist, MRS 1523	5 MG	119152-5MG	39,000
AhR Antagonist III, GNF351	10 MG	182707-10MG	38,900
CXCR2 Antagonist, Cpd 19	2 MG	239819-2MG	19,000
CXCR3 Antagonist	1 MG	5.00486.0001	28,000

Antagonists の続き	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
CXCR4 Antagonist IV, TF14016	2 MG	5.00507.0001	42,000
Dopamine Receptor Antagonist II, Thioridazine, HCl	2GM	324387-2GM	15,000
Eliprodil	10 MG	5.04539.0001	33,000
Ghrelin receptor antagonist, JMV 2959	10 MG	345888-10MG	38,000
GPR55 Receptor Antagonist, CID16020046	10 MG	5.06045.0001	37,000
InSolution Wnt Antagonist I, IWR-1-endo	5 MG	5.04462.0001	17,000
P2X Antagonist III	10 MG	5.04660.0001	42,000
P2Y Antagonist II	10 MG	5.04187.0001	39,000
PPARb/d Antagonist, GSK3787	10 MG	516567-10MG	19,000
QNZ46	5 MG	5.04535.0001	18,000
RAGE Antagonist, FPS-ZM1	25 MG	553030-25MG	38,900
TRPV4 Antagonist I, RN-1734	10 MG	616520-10MG	18,900
TRPV4 Antagonist II, HC-067047	10 MG	616521-10MG	48,900
TRPV4 Antagonist III, GSK205	10 MG	616522-10MG	お問合せ

Antibiotics

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Divin	25 MG	5.05757.0001	35,000

Anticancer Agents

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Amifostine	50 MG	129874-50MG	22,000
Gemcitabine, HCl	50 MG	5.04594.0001	23,000
HMTase Inhibitor IV, UNC0638	2 MG	382192-2MG	14,000
HMTase Inhibitor V, UNC0224	5 MG	382193-5MG	44,000
Temozolomide	50 MG	5.00609.0001	26,000

Apoptosis & Necrosis Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Cancer Hydrolase KIAA1363 Inhibitor, JW480	10 MG	420175-10MG	14,900
Carbonic Anhydrase IX/XII Inhibitor	5 MG	215900-5MG	13,900
Carbonic Anhydrase IX/XII Inhibitor II, U-104	5 MG	215901-5MG	14,000
Cdc2-Like Kinase Inhibitor IV, KH-CB19	10 MG	219511-10MG	28,000
Cdk4 Inhibitor V	5 MG	219503-5MG	28,000
Choline Kinase-a Inhibitor, CK37	5 MG	229103-5MG	29,000
CRM1 Inhibitor III	10 MG	238100-10MG	17,000
Foxo1 Inhibitor, AS1842856	10 MG	344355-10MG	25,900
GSK-3 beta Inhibitor XXIV	5 MG	361567-5MG	23,000
GSK-3b Inhibitor XXV	10 MG	361568-10MG	17,000
Hdm2 E3 Ligase Inhibitor II, HLI373	5 MG	373226-5MG	16,000
Heat Shock Factor 1 Inhibitor, KRIBB11	10 MG	385570-10MG	38,900
HIF Inhibitor VI	5 MG	400086-5MG	61,000
HIF-PHD Inhibitor II, JNJ-42041935	10 MG	400093-10MG	48,900
Histone Methyltransferase EZH2 Inhibitor, DZNep	2 MG	252790-2MG	38,900
InhibitorSelect ™ mTOR Signaling Inhibitors	1EA	475995-1EA	318,000
Kir2.1 Inhibitor, ML133	5 MG	422689-5MG	14,000
Mcl-1 Inhibitor, MIM1	25 MG	444130-25MG	38,000
MDMX Inhibitor, NSC207895	10 MG	444158-10MG	22,900
mitoNEET InhibitorNL-1,Thiazolidinedione	10 MG	475825-10MG	23,000
MLKL Inhibitor, Necrosulfonamide	25 MG	480073-25MG	38,900
MNK1/2 Inhibitor II, ETP-45835	10 MG	454862-10MG	29,000
nNOS - PSD-95 InteractionInhibitor,ZL006	10 MG	482740-10MG	16,000
PDE4D Inhibitor, GEBR-7b	5 MG	524748-5MG	16,000
PLD Inhibitor, FIPI	5 MG	528245-5MG	16,900
RGS Proteins Inhibitor II, CCG-50014	10 MG	554995-10MG	15,900
RIP1 Inhibitor II, 7-Cl-O-Nec-1	10 MG	5.04297.0001	39,000

阻害剤関連製品の最新情報はこちらから >> www.merckmillipore.jp/sogaizai

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

ATPase & GTPase Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
CDC42 Inhibitor III, ZCL278	25 MG	5.00503.0001	37,000
Cdc42/Rac1 GTPase Inhibitor, ML141	25 MG	217708-25MG	38,900
Cytoplasmic Dynein Inhibitor, Ciliobrevin D	10 MG	250401-10MG	38,900
InSolution ™ Thapsigargin	2 MG	586006-2MG	39,000
Rab7 GTPase Inhibitor, CID 1067700	10 MG	553326-10MG	38,900
Rac Inhibitor III, EHop-016	10 MG	553513-10MG	38,900
Rho Inhibitor II	10 MG	5.04043.0001	30,000
Rho Inhibitor, Rhosin	25 MG	555460-25MG	24,900

Calcium Signaling Modulators

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
L-type Calcium Channel Blocker VIII	25 MG	208294-25MG	24,000
RyR-Calstabin Interaction Stabilizer, S107	10 MG	5.00469.0001	38,000
TPRC3 Channel Inhibitor III, Pyr10	10 MG	648494-10MG	29,000
TRPM4 Inhibitor, 9-Phenanthrol	50 MG	648492-50MG	18,900

Cell Cycle, Division, & Adhesion Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
InSolution Chk2 Inhibitor II	5 MG	220491-5MG	28,000
5-Azacytidine	250 MG	5.04317.0001	17,000
CRM1 Inhibitor IV, KPT-251	5 MG	5.00505.0001	48,000
Ezh2 Inhibitor II, EI1	10 MG	5.00561.0001	39,000
HDAC Inhibitor XVII	10 MG	5.00671.0001	39,000
HDAC Inhibitor XXIII, Tubastatin A	5 MG	382187-5MG	23,900
Histone Acetyltransferase Inhibitor VIII, NU9056	10 MG	5.00511.0001	37,000
Histone Acetyltransferase p300 Inhibitor II, L002	10 MG	5.05298.0001	22,000
Histone Lysine Demethylase I	10 MG	420204-10MG	33,000
Histone Lysine Demethylase Inhibitor IX, PBIT	25 MG	5.05299.0001	35,000
Histone Lysine Demethylase Inhibitor VIII, GSK-J4	10 MG	420205-10MG	40,000
HMTase Inhibitor IX, MM-102	10 MG	5.00649.0001	42,000
InSolution 5-Aza-2'-Deoxycytidine	10 MG	189826-10MG	29,000
InSolution RNA Polymerase III Inhibitor	5 MG	557404-5MG	22,900
InSolution ™ Cdk1 Inhibitor IV, RO-3306	2 MG	217721-2MG	26,000
JMJD Histone Demethylase Inhibitor III	5 MG	420202-5MG	38,900
JMJD Histone Demethylase Inhibitor IV, M	10 MG	420203-10MG	38,900
LSD1 Inhibitor III, CBB1007	10 MG	489478-10MG	38,900
LSD1 Inhibitor IV, RN-1,HCl	10 MG	489479-10MG	34,900
PPAR Agonist IX, GQ-16	25 MG	516571-25MG	40,000
PRMT Inhibitor VI	10 MG	539214-10MG	お問合せ
Protein Methyltransferase Inhibitor II, BIX-01338	2 MG	539212-2MG	14,000
Sirt1 Inhibitor VII, Inauhzin	10 MG	566332-10MG	19,900
TLR3/dsRNA Complex Inhibitor	10 MG	614310-10MG	38,900
Topoisomerase II Inhibitor, BNS-22	10 MG	614853-10MG	19,900

DNA Damage & Repair Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
APE1 Inhibitor III	10 MG	262017-10MG	40,000
ATR Inhibitor IV	10 MG	5.04972.0001	37,000
MDM2/MDMX Dual Inhibitor, RO-5963	10 MG	444153-10MG	42,000
mTOR Inhibitor XI, ETP-46464	10 MG	5.00508.0001	37,000
RAD51 Inhibitor II, RI-1	10 MG	553514-10MG	34,900
TMEM16A Inhibitor, T16Ainh-A01	5 MG	613551-5MG	38,900

Extracellular Matrix & Adhesion Modulators

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
InSolution Cytochalasin D, Zygosporium mansonii	1 MG	5.04776.0001	21,000

Immunomodulators

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
OXE-R-Gβγ Coupling Modulator	25 MG	370681-25MG	26,000
TLR1/TLR2 Antagonist, CU-CPT22	10 MG	614305-10MG	34,000
TLR4 Inhibitor, TAK-242	5 MG	614316-5MG	32,900

Inducers

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
CBFbeta Activator, Kartogenin	25 MG	420358-25MG	40,000
Mitochondrial ATF Translocator, SBI-0087702	10 MG	5.05988.0001	37,000
Mitochondrial Fusion Promoter, M1	25 MG	475859-25MG	17,000
Novel Inducer of Death-1, NID-1	25 MG	5.06075.0001	37,000

Lipid Signaling Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
15-PGDH Inhibitor	10 MG	100073-10MG	19,000
Autotaxin Inhibitor III, PF-8380	10 MG	189512-10MG	38,900
Autotaxin Inhibitor IV, HA155	10 MG	189513-10MG	22,000
Ceranib-2	10 MG	219556-10MG	22,000
FATP2 Inhibitor, CB-2	10 MG	5.00670.0001	28,000
Fatty Acid Synthase Inhibitor, Cpd 10v	5 MG	341326-5MG	24,900
Indomethacin, 2′ -Trifluoromethyl	10 MG	5.04924.0001	28,000
InSolution Fluvastatin, Sodium Salt	10 MG	344096-10MG	29,000
InSolution Lovastatin, Sodium Salt	5 MG	438187-5MG	40,000
InSolution Simvastatin, Sodium Salt	5 MG	567022-5MG	28,000
Licofelone, Potassium Salt, Monohydrate	25 MG	435801-25MG	28,000
Sphingosine Kinase 1 Inhibitor II, PF-54	5 MG	567741-5MG	17,000
Sphingosine Kinase 1 Inhibitor, SKI-178	10 MG	567732-10MG	16,000
Sphingosine Kinase Inhibitor	10 MG	5.00489.0001	24,000
$sPLA_2$-IIA Inhibitor II, KH064	10 MG	525146-10MG	39,000

Neurobiology & Neurodegeneration Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
InSolution b-Secretase Inhibitor IV	500UG	565794-500UG	18,900
KMO Inhibitor I, Ro 61-8048	10 MG	420360-10MG	29,000
KMO Inhibitor II, JM6	10 MG	420361-10MG	19,000
γ Secretase Inhibitor, FT-9	10 MG	500587-10MG	28,000

Neurochemicals

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Ionomycin, Calcium Salt, Streptomyces conglobatus in Solution	2 MG	407953-2MG	36,000
(-)-Cytisine	10 MG	5.05227.0001	15,000
(+)-Bicuculline	50 MG	5.05875.0001	33,000
(+)-WIN 55,212-2 mesylate	5 MG	5.04344.0001	8,000
(+/-)-Atenolol	1GM	5.05416.0001	20,000
(+/-)-Clopidogrel Hydrogensulfate	5 MG	5.05762.0001	44,000

新製品

Neurochemicals の続き	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
(±)-Epibatidine dihydrochloride	5 MG	5.05414.0001	39,000
(±)-PD 128907 Hydrochloride	5 MG	5.05897.0001	15,000
(−)-Quinpirole Hydrochloride	10 MG	5.05982.0001	お問合せ
(2R,4R)-APDC	1 MG	5.04472.0001	20,000
(2S,4R)-4-methylglutamate	1 MG	5.05019.0001	28,000
(R)-(+)-SKF38393 Hydrochloride	5 MG	5.05881.0001	お問合せ
(R)-Baclofen	10 MG	5.05873.0001	15,000
(R)-CPP	10 MG	5.04839.0001	55,000
(R)-CPPene	10 MG	5.04840.0001	53,000
(RS)-PPG 1 PC X 5 MG	5 MG	5.04395.0001	24,000
(S)-(-)-Raclopride	10 MG	5.05877.0001	お問合せ
(S)-3,4-DCPG	10 MG	5.04375.0001	37,000
(S)-MCPG 1 PC X 10 MG	10 MG	5.04637.0001	35,000
(S)-Sulpiride	100 MG	5.05626.0001	お問合せ
1,1-Dimethyl-4-phenylpiperazinium iodide	1GM	5.05412.0001	13,000
2,3 cis-Piperidine dicarboxylic acid	50 MG	5.05051.0001	22,000
4-DAMP	25 MG	5.05771.0001	お問合せ
5-BDBD	5 MG	5.05736.0001	26,000
5-Iodo-A-85380 dihydrochloride hydrate	5 MG	5.05413.0001	26,000
5,7-Dichlorokynurenic acid sodium salt	10 MG	5.04841.0001	13,000
7-Chlorokynurenic Acid Sodium Salt	10 MG	5.04844.0001	13,000
A 438079	10 MG	5.05315.0001	26,000
a-(Methylamino)isobutyric Acid	250 MG	5.06129.0001	22,000
A317491	5 MG	5.05478.0001	46,000
A740003	5 MG	5.08317.0001	26,000
AF-DX 116	10 MG	5.05821.0001	22,000
AF353	5 MG	5.05418.0001	28,000
AIDA 1 PC X 5 MG	5 MG	5.04394.0001	39,000
AM251	5 MG	5.04275.0001	13,000
AMN082 Dihydrochloride	10 MG	5.04745.0001	17,000
Aniracetam	50 MG	5.04913.0001	20,000
APETx2, Anthopleura elegantissima, Recombinant, *E. coli.*	100UG	5.00527.0001	66,000
ASIC Channel Modulator II, GMQ	25 MG	5.00523.0001	35,000
ATPA	1 MG	5.05018.0001	11,000
Bethanechol Chloride	5GM	5.05773.0001	お問合せ
BINA	5 MG	5.04463.0001	27,000
BRL 44408 Maleate	10 MG	5.04795.0001	33,000
Bupropion Hydrochloride	50 MG	5.06239.0001	お問合せ
BzATP Triethylammonium Salt	1 MG	5.05734.0001	13,000
CGP 35348	10 MG	5.05895.0001	お問合せ
CGP 37849	10 MG	5.04842.0001	28,000
CGP 7930	10 MG	5.05894.0001	26,000
Cinnabarinic acid	10 MG	5.04820.0001	24,000
CIQ	5 MG	5.04519.0001	26,000
CL316243 Hydrate	5 MG	5.04761.0001	36,000
CNQX	10 MG	5.04914.0001	お問合せ
CNS-1102	10 MG	5.04522.0001	50,000
CP-101,606	5 MG	5.04523.0001	22,000
CP-55940	5 MG	5.04316.0001	23,000
CPCCOEt	5 MG	5.04713.0001	28,000
CTAP	1 MG	5.08316.0001	24,000
CTOP	1 MG	5.08015.0001	お問合せ
CX546	10 MG	5.05016.0001	31,000
Cyclothiazide	10 MG	5.05415.0001	お問合せ
DNQX Disodium Salt	10 MG	5.05026.0001	13,000
DPDPE	1 MG	5.08160.0001	20,000
Dynorphin A	1 MG	5.08016.0001	お問合せ
EGLU	5 MG	5.04378.0001	20,000
Fenobam 1 PC X 5 MG	5 MG	5.04684.0001	16,000

Neurochemicals の続き	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
FFN511	1 MG	5.05483.0001	お問合せ
Flumazenil	10 MG	5.05991.0001	お問合せ
Gallamine Triethiodide	5GM	5.05311.0001	31,000
GBR 12909 Dihydrochloride	10 MG	5.05732.0001	15,000
GIRK Activator, ML297	10 MG	5.05820.0001	37,000
GR 127935 Hydrochloride	10 MG	5.08014.0001	お問合せ
GR113808	10 MG	5.08120.0001	24,000
GYKI 52466 Hydrochloride	10 MG	5.04973.0001	22,000
GYKI 53655 Hydrochloride	10 MG	5.05296.0001	42,000
Herkinorin	1 MG	5.08018.0001	お問合せ
Hexamethonium Bromide	5GM	5.05313.0001	11,000
Homoquinolinic acid	10 MG	5.04483.0001	44,000
Ibotenic Acid	1 MG	5.05024.0001	22,000
Idazoxan Hydrochloride	50 MG	5.04746.0001	18,000
Ifenprodil Hemitartrate	10 MG	5.04904.0001	13,000
InSolution ™ TNP-ATP	1 MG	5.08319.0001	35,000
JNJ 16259685	5 MG	5.04479.0001	24,000
JWH 015	5 MG	5.04274.0001	15,000
Ketanserin Tartrate	50 MG	5.06271.0001	お問合せ
Kir1.1 Inhibitor, VU591	5 MG	422682-5MG	9,000
Kynurenic Acid Sodium Salt	1GM	5.05027.0001	15,000
L-701,324	10 MG	5.04481.0001	33,000
L-741,626	10 MG	5.05879.0001	24,000
L-745,870 Trihydrochloride	10 MG	5.05880.0001	26,000
L-CCG-I	1 MG	5.04467.0001	17,000
Loperamide Hydrochloride	1GM	5.08162.0001	15,000
LP-44 Hydrochloride	10 MG	5.08155.0001	33,000
LY 344864 Hydrochloride	10 MG	5.08150.0001	33,000
LY 354740	10 MG	5.04685.0001	26,000
LY 367385 Hydrochloride 1 PC X 5 MG	5 MG	5.04658.0001	20,000
LY-404,039	5 MG	5.04466.0001	20,000
Mecamylamine Hydrochloride	10 MG	5.05207.0001	13,000
Memantine Hydrochloride	50 MG	5.04905.0001	15,000
Methyllycaconitine Citrate	5 MG	5.05208.0001	13,000
Methysergide Maleate	10 MG	5.06419.0001	31,000
MMPIP 1 PC X 1 MG	1 MG	5.04634.0001	10,000
MPEP Hydrochloride 1 PC X 10 MG	10 MG	5.04635.0001	22,000
MPTP Hydrochloride	10 MG	5.06382.0001	26,000
MRS 2211	10 MG	5.05481.0001	お問合せ
MTEP Hydrochloride	10 MG	5.04633.0001	22,000
Muscimol	1 MG	5.06044.0001	お問合せ
NAAG	50 MG	481920-50MG	20,000
Nebivolol Hydrochloride	10 MG	5.04778.0001	19,000
Nefazodone Hydrochloride	10 MG	5.08148.0001	22,000
Neurotrope J147	10 MG	480850-10MG	40,000
NMDA Antagonist XI, N1-dansyl-spermine	10 MG	5.05764.0001	31,000
NMDAR2C/2D Inhibitor, DQP-1105	10 MG	454586-10MG	29,000
nor-Binaltorphimine Dihydrochloride	10 MG	5.08017.0001	お問合せ
NS1738	10 MG	5.05983.0001	26,000
NS3763	5 MG	5.05020.0001	37,000
NS8593	10 MG	492031-10MG	29,000
NVP-AAM077 Tetrasodium Hydra	5 MG	5.04528.0001	28,000
O-1602	5 MG	5.04368.0001	24,000
Oxidized ATP (oATP)	25 MG	5.05758.0001	37,000
Oxymetazoline Hydrochloride	5GM	5.05417.0001	28,000
Palmitoylethanolamide	10 MG	5.04359.0001	11,000
Pancuronium Dibromide	10 MG	5.05226.0001	11,000
Paroxetine Hydrochloride	10 MG	5.06125.0001	17,000
PD 168077 Maleate	10 MG	5.05878.0001	お問合せ

阻害剤関連製品の最新情報はこちらから >> www.merckmillipore.jp/sogaizai

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

Neurochemicals の続き	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
PHA-543,613	5 MG	5.05316.0001	28,000
PHCCC	10 MG	5.04632.0001	22,000
Philanthotoxin-7,4	1 MG	5.04974.0001	11,000
Pirenzepine Dihydrochloride	100 MG	5.05772.0001	お問合せ
PK11195	10 MG	5.05981.0001	15,000
PNU-120596	10 MG	528201-10MG	50,000
Pramipexole Dihydrochloride	10 MG	5.05486.0001	13,000
Prazosin Hydrochloride	50 MG	5.04772.0001	11,000
Reboxetine Mesylate	10 MG	5.04120.0001	24,000
Ro 25-6981 Maleate Salt	1 MG	5.04845.0001	13,000
Rotigotine Hydrochloride	10 MG	5.05724.0001	20,000
RS 127445 Hydrochloride	10 MG	5.08147.0001	31,000
RuBi-Nicotine	5 MG	5.05222.0001	28,000
S 24795	10 MG	5.05228.0001	20,000
S18986	5 MG	5.04983.0001	37,000
Salbutamol Hemisulfate	25 MG	5.04794.0001	15,000
Salmeterol Xinafoate	10 MG	5.04815.0001	28,000
Salvinorin A	1 MG	5.08159.0001	26,000
SB 206553 Hydrochloride	10 MG	5.06272.0001	お問合せ
SB 242084 Hydrochloride	10 MG	5.06417.0001	お問合せ
SB 399885 Hydrochloride	10 MG	5.08119.0001	35,000
SB 699551 Dihydrochloride	10 MG	5.08149.0001	33,000
SB-269970 Hydrochloride	10 MG	5.06415.0001	お問合せ
SB-277011-A Dihydrochloride	5 MG	5.05484.0001	お問合せ
SCH 23390 Hydrochloride	10 MG	5.05723.0001	26,000
SNC80	10 MG	5.08161.0001	33,000
SR 144528	5 MG	5.04277.0001	27,000
SR95531 (Gabazine)	10 MG	5.05986.0001	24,000
Tamsulosin Hydrochloride	10 MG	5.04793.0001	28,000
TCN-201	5 MG	5.04596.0001	22,000
Tiagabine Hydrochloride	10 MG	5.06236.0001	お問合せ
TrpA1 Antagonist, HC-030031	10 MG	648485-10MG	12,900
UBP310	10 MG	5.05017.0001	28,000
Vigabatrin	10 MG	5.05989.0001	お問合せ
VU0155041 Sodium Salt	10 MG	5.04396.0001	9,000
WAY-100635 Maleate	10 MG	5.08146.0001	28,000
Xanomeline Oxalate	10 MG	5.05816.0001	お問合せ
YM298198 Hydrochloride	10 MG	5.04597.0001	28,000
Yohimbine Hydrochloride	1GM	5.04777.0001	9,000
α, β-methylene ATP	5 MG	5.05419.0001	37,000

NF-κB Activation Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
CRAC Channel Inhibitor IV, EVP4593	5 MG	481417-5MG	23,000
NBD-Binding Peptide II, Cell Permeable, CTP-NBD	5 MG	480026-5MG	33,900
Nodinitib-1	10 MG	488004-10MG	19,000

Nitric Oxide & Oxidative Stress Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
NOX Inhibitor VII, Thr101	25 MG	5.00526.0001	37,000
Myeloperoxidase Inhibitor-II	10 MG	5.04908.0001	22,000
Neuroprotectant, OBA-09	25 MG	494105-25MG	22,000

Phosphorylation & Dephosphorylation Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Akt Inhibitor XIX, 3CAI	25 MG	124037-25MG	19,000

Phosphorylation & Dephosphorylation Inhibitors の続き	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Akt Inhibitor XVI, AT7867	10 MG	124033-10MG	お問合せ
Akt Inhibitor XVIII, SC66	25 MG	124036-25MG	22,000
Anaphase-Promoting Complex Inhibitor Negative Control, AAME	50 MG	172103-50MG	9,000
Aurora Kinase Inhibitor VI, ZM447439	5 MG	189410-5MG	18,900
Aurora Kinase Inhibitor XI, HOI-07	10 MG	189412-10MG	お問合せ
Bcr-abl Inhibitor IV, Imatinib	50 MG	5.04595.0001	20,000
BMX-IN-1	10 MG	5.05021.0001	42,000
CaMKII Inhibitor XII	5 MG	208923-5MG	26,000
Casein Kinase I Inhibitor III,PF-4800567	5 MG	218719-5MG	40,000
Casein Kinase I Inhibitor V, LH846	10 MG	218850-10MG	28,900
Casein Kinase II Inhibitor VIII	10 MG	218860-10MG	20,000
Casein Kinase II Inhibitor XII, TBBz	20 MG	5.05766.0001	44,000
Cdc25 Inhibitor IV, NSC 95397	10 MG	217694-10MG	17,000
eEF2K Inhibitor, A-484954	10 MG	324516-10MG	38,900
EphA Antagonist	10 MG	5.00713.0001	24,000
ERK Inhibitor VIII	10 MG	328011-10MG	42,000
ERK Kinase Kinase 5 Inhibitor	10 MG	178506-10MG	33,000
FMS/KIT Dual Kinase Inhibitor, PLX647	10 MG	5.05146.0001	15,000
Focal Adhesion Kinase Inhibitor III	10 MG	5.04045.0001	37,000
GSK-3beta Inhibitor XXVI	5 MG	361569-5MG	19,000
Haspin Kinase Inhibitor, CHR-6494	10 MG	372040-10MG	40,000
HePTP Inhibitor, ML119	10 MG	375645-10MG	28,900
ILK Inhibitor, Cpd 22	5 MG	407331-5MG	38,900
InSolution 1-Azakenpaullone	500UG	191501-500UG	14,000
InSolution Casein Kinase II Inhibitor III, TBCA	5 MG	218861-5MG	36,000
InSolution eIF-2alpha Inhibitor, Salubrinal	5 MG	324897-5MG	37,000
InSolution GSK-3 Inhibitor XVI, CHIR99021	5 MG	361571-5MG	38,900
InSolution MEK1/2 Inhibitor III, PD03259	5 MG	444968-5MG	29,000
InSolution PKR Inhibitor	5 MG	527451-5MG	25,000
InSolution PP1 Analog II, 1NM-PP1	1 MG	529606-1MG	25,000
InSolution ™ Interleukin-1 Receptor-Associated-Kinase-1/4 I	5 MG	407602-5MG	25,900
JAK3 Inhibitor VIII, NSC114792	10 MG	420146-10MG	40,000
JNK Inhibitor XV, IQ-1S	25 MG	420149-25MG	40,000
LIM Kinase Inhibitor I, LIMKi 3	10 MG	435930-10MG	36,000
LRRK2 Inhibitor II, CZC-25146	10 MG	438194-10MG	25,000
LRRK2 Inhibitor III, HG-10-102-01	10 MG	438195-10MG	28,900
LYP Inhibitor II, LTV-1	10 MG	540218-10MG	14,000
Mirk/Dyrk1B Inhibitor, Compo	10 MG	475857-10MG	36,000
MMP-2 Inhibitor IV	10 MG	444294-10MG	25,000
mTOR Inhibitor XI, Torin1	10 MG	475991-10MG	32,000
mTOR Inhibitor XII, Torin2	10 MG	475992-10MG	32,000
p21-Activated Kinase Inhibitor II, PF-3758309	5 MG	5.00613.0001	42,000
p38 MAP Kinase Inhibitor XI	10 MG	506173-10MG	お問合せ
p38 MAP Kinase Inhibitor XIX, Skepinone-L	5 MG	506174-5MG	37,180
PERK Inhibitor I, GSK2606414	5 MG	516535-5MG	48,900
PI 3-K Inhibitor XVIII	10 MG	5.00499.0001	48,000
PI 3-K/mTOR Inhibitor III, PKI-179	5 MG	526561-5MG	28,900
PI 3,4-K inhibitor, PIK-93	5 MG	528122-5MG	29,000
PIM-Kinase Inhibitor IX, SGI-1776	10 MG	526528-10MG	38,900
PIM-Kinase Inhibitor X, CX-6258	10 MG	526529-10MG	28,900
Polo-like Kinase Inhibitor V, Poloxin	5 MG	528884-5MG	24,900
PP1 Analog IV, 3-IB-PP1	10 MG	529598-10MG	22,000
Prodigiosin Serratia marcescens	200UG	529685-200UG	16,000
PTP Inhibitor XXXI, II-B08	10 MG	565852-10MG	28,000
RSK2 Inhibitor, RMM-46	10 MG	5.05300.0001	39,000
SRPK Inhibitor, SRPIN340	10 MG	5.04293.0001	38,000
STAT3 Inhibitor XI, STX-0119	25 MG	573126-25MG	29,000
STAT3 Inhibitor XII, SPI	5 MG	573127-5MG	44,000
STAT3 Inhibitor XVIII, BP-1-102	10 MG	573132-10MG	34,900

新製品

Phosphorylation & Dephosphorylation Inhibitors の続き	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Syk Inhibitor VI, R406	5 MG	5.05819.0001	お問合せ
Thymidylate Kinase Inhibitor, YMU1	10 MG	606015-10MG	28,900
Tie2/Trk Dual Inhibitor	10 MG	5.04981.0001	39,000
Trk Inhibitor III, GNF-5837	10 MG	648451-10MG	38,900

Ubiquitin Ligase and Protease Inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Bmi1-Ring1A E3 Ligase Inhibitor, PRT4165	25 MG	203630-25MG	36,000
Bortezomib	5 MG	5.04314.0001	20,000
DUB Inhibitor VI, P22077	25 MG	662142-25MG	21,900
FAAH Inhibitor III, URB937	5 MG	341253-5MG	24,000
Glutaminase Inhibitor, Compound 968	10 MG	352010-10MG	38,900
MDM2 Inhibitor VII, MEL23	10 MG	373227-10MG	21,900
MMP-9 Inhibitor II	10 MG	444293-10MG	20,000
MT1-MMP Inhibitor, NSC405020	25 MG	444295-25MG	21,900
NAE Inhibitor, MLN4924	5 MG	5.05477.0001	お問合せ
PrCP Inhibitor	10 MG	5.04044.0001	42,000
Proteasome Inhibitor XXI, Z-LLLL-SF	5 MG	5.00502.0001	37,000
Rad6 Inhibitor	10 MG	5.00655.0001	31,000
SKP2 E3 Ligase Inhibitor I, C1	25 MG	5.00519.0001	38,000
SKP2 E3 Ligase Inhibitor II, SMIP004	25 MG	5.00517.0001	37,000

Signaling related inhibitors

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
17bHydroxysteroidDehydrogenasetype3Inhib	10 MG	385585-10MG	19,000
3-Nitropropionic acid	50 MG	164603-50MG	9,000
Acidic Mammalian Chitinase Inhib, Bisdionin	5 MG	112252-5MG	25,000
Adenosine Deaminase Inhibitor, DCF	10 MG	116860-10MG	16,000
AKR1C3 Inhibitor	25 MG	123855-25MG	19,900
Aromatase Inhibitor II, Letrozole	25 MG	182541-25MG	16,000
ATR Kinase Inhibitor II	10 MG	118510-10MG	42,000
Autophagy Inhibitor IV, Cpd1	10 MG	5.05980.0001	20,000
BCRP Inhibitor III, YHO-13177	10 MG	197227-10MG	22,000
Berberine Chloride	25 MG	200275-25MG	4,000
BX471	5 MG	5.04345.0001	29,000
CaCC Blocker IV, Benzbromarone	100 MG	5.04041.0001	13,000
Carbonic Anhydrase IX Inhibitor III, Methazolamide	50 MG	215902-50MG	19,000
CBFb-Runx1 Inhibitor II, Ro5-3335	10 MG	219506-10MG	40,000
CDDO-Me	10 MG	5.05308.0001	お問合せ
D-Amino Acid Oxidase Inhibitor III, AS057278	50 MG	251406-50MG	14,000
eIF2-GTP-tRNAiMetTernaryCompInhib,BTdCPU	10 MG	324892-10MG	9,000
eIF2-GTP-tRNAiMetTernaryCompInhibNCPdCPU	10 MG	324889-10MG	9,000
ERO1 Inhibitor I, Erodoxin	25 MG	328500-25MG	25,000
ERO1 Inhibitor II, EN460	25 MG	328501-25MG	34,900
Ezrin Inhibitor, NSC668394	10 MG	341216-10MG	13,900
Fbxo3 Inhibitor, BC-1215	10 MG	5.04843.0001	37,000
FtsZ Polymer Stabilizer, PC1	5 MG	344580-5MG	23,000
Fucosyltransferase Inhibitor, 2F-Peracetyl-Fucose	10 MG	344827-10MG	32,000
Glucose Transporter Inhibitor II	10 MG	400035-10MG	26,000
Glucose Transporter Inhibitor IV, WZB117	25 MG	400036-25MG	34,900
GPCR-Helix 8 Signaling Inhibitor, JF5	10 MG	371825-10MG	38,900
GPR119 Agonist, AS1269574	10 MG	371724-10MG	50,000
HIF Inhibitor V	10 MG	5.00498.0001	33,000
HIF Inhibitor VII	10 MG	5.04379.0001	39,000
HNF4 Antagonist, BI6015	25 MG	375240-25MG	38,900

Signaling related inhibitors の続き	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
HSP70 Activator II, YM-08	10 MG	5.05276.0001	42,000
ICMT Inhibitor II, FTPAT	10 MG	420351-10MG	28,000
IDH1 Inhib, R132 Somatic Mutant-Specific	25 MG	410972-25MG	31,000
INCB 3284 dimesylate	5 MG	5.04361.0001	22,000
InhibitorSelect ™ TLR Signaling Pathway Panel	1EA	5.00528.0001	297,000
InSolution eIF4E/eIF4G Interaction Inhibitor, 4EGI-1	5 MG	324519-5MG	28,900
InSolution ™ CFTR Inhibitor-172	5 MG	219674-5MG	33,000
InSolution ™ PARP Inhibitor VIII, PJ34	2 MG	528151-2MG	23,000
InSolution ™ Tetrahydrouridine	25 MG	584223-25MG	32,000
IRE1 Inhibitor II	25 MG	412511-25MG	36,000
IRE1 Inhibitor III, 4u8C	25 MG	412512-25MG	34,900
JQ1 Enantiomers Set	1SET	500586-1SET	48,000
KLF5 Inhibitor, CID 5951923	10 MG	422625-10MG	29,000
L- Buthionine Sulfoximine	100 MG	5.08228.0001	20,000
L3MBTL3 MBT Domain Blocker, UNC1215	10 MG	5.00557.0001	28,000
Lactimidomycin	0.2 MG	5.06291.0001	66,000
LDN-211904	5 MG	428201-5MG	34,000
LSF Inhibitor, FQI1	10 MG	438210-10MG	16,000
MALT1 Inhibitor I, MI-2	10 MG	5.00491.0001	35,000
MALT1 Inhibitor II	25 MG	5.00500.0001	35,000
MAT2A Inhibitor II, FIDAS-5	10 MG	5.04173.0001	33,000
Menin-MLL Interaction Inhibitor, MI-2-2	10 MG	444825-10MG	33,000
MitoBloCK-6	25 MG	5.05759.0001	37,000
Mitochondrial Pyruvate Carrier Inhibitor, UK5099	5 MG	5.04817.0001	お問合せ
Mitochondrial Pyruvate Carrier Inhibitor, UK5099	25 MG	5.04817.0002	お問合せ
mTOR Activator, MHY1485	10 MG	5.00554.0001	38,000
Nef Hck Activation Inhibitor, B9	10 MG	5.00653.0001	33,000
NF-kappaB Inhibitor Methysticin	5 MG	480458-5MG	53,000
NFAT Inhibitor, MCV1	2 MG	480404-2MG	32,000
O-GlcNAcase Inhibitor, TMG	25 MG	110165CBC-25MG	22,000
PDE10A Inhibitor, Cpd15	5 MG	513050-5MG	25,000
PFKFB3 Inhibitor, 3PO	25 MG	525330-25MG	18,900
Piperlongumine	25 MG	528124-25MG	9,000
PKR Inhibitor III, 7DG	5 MG	5.05892.0001	26,000
PPARb/d Antagonist, PT-S58	10 MG	516569-10MG	22,000
PPARbeta/delta Inverse Agonist	10 MG	516568-10MG	22,000
Protein Disulfide Isomerase Inhibitor III PACMA31	25 MG	539225-25MG	お問合せ
PSD95 Inhibitor, Tat-N-dimer	2 MG	529542-2MG	25,000
Quisqualic acid	5 MG	5.04631.0001	17,000
RAGE Antagonist Peptide, RAP	10 MG	553031-10MG	34,900
RS 102895 hydrochloride	5 MG	5.04376.0001	31,000
Sialyltransferase Inhibitor, 3Fax-Peracetyl Neu5Ac	10 MG	566224-10MG	28,900
STAT3 Inhibitor XIV, LLL12	10 MG	573131-10MG	28,900
Stearoyl-CoA Desaturase Inhibitor, MF-43	10 MG	569406-10MG	28,000
Survivin Inhibitor III	10 MG	5.00614.0001	お問合せ
Survivin Inhibitor, YM155	10 MG	574662-10MG	14,900
Tankyrase 1/2 Inhibitor VI, G007-LK	10 MG	5.04907.0001	42,000
Tankyrase1/2 Inhibitor III	10 MG	575546-10MG	29,000
Tankyrase1/2 Inhibitor IV, JW55	25 MG	575547-25MG	38,900
TCEP, Hydrochloride, Reagent	5GM	580567-5GM	39,380
Urea Transporter B Inhibitor	10 MG	666125-10MG	お問合せ
Vicriviroc Malate	5 MG	5.04373.0001	53,000
InSolution Cyclopamine, V. californicum	5 MG	239806-5MG	40,000

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

Stem Cell Biology

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
b-Catenin/Tcf Inhibitor V, BC21	5 MG	219334-10MG	28,900
iPSC Induction Enhancer II, OAC1	25 MG	5.00501.0001	37,000
ML243	25 MG	5.04599.0001	33,000
PKC Activator VIII, CGK062	2 MG	5.04276.0001	40,000
Porcn Inhibitor II, C59	10 MG	5.00496.0001	33,000
Porcn Inhibitor III, IWP-L6	10 MG	5.04819.0001	42,000
Tankyrase1/2 Inhibitor	10 MG	5.00556.0001	31,000
β-Catenin/Tcf Inhibitor VI, ICG-001	10 MG	5.04712.0001	42,000

Substrates

	内容量	カタログ番号	希望販売価格(¥)
DMBO	10 MG	317201-10MG	9,000
Hh Signaling Antagonist XI, MRT-14	10 MG	373277-10MG	20,000
Hh Signaling Antagonist XII, MRT-83	5 MG	373278-5MG	40,000
Importazole	10 MG	401105-10MG	29,000
INDY	5 MG	405273-5MG	26,900
iPSC Induction Enhancer, Thiazovivin	10 MG	420220-10MG	27,000
Ischemin	25 MG	410960-25MG	38,900
Longdaysin	10 MG	438075-10MG	19,000
MIF Antagonist IV, RDR 03785	10 MG	475847-10MG	35,000
MyoVin-1	5 MG	475984-5MG	34,900
PIP3 Antagonist II, DM-PIT-1	25 MG	524619-25MG	23,000
PIP3 Antagonist, PITenin-7	10 MG	524618-10MG	16,000
Pro-survival Compound, DDD00033325	10 MG	529659-10MG	23,000
proINDY	5 MG	537000-5MG	27,000
TNP-470	10 MG	654270-10MG	51,000
WP1130	10 MG	681685-10MG	35,900

プロテアーゼ阻害剤

Caplain 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Calpeptin	117591-20-5	362.5	≥ 94% by HPLC	-20℃	DMF (5 mg/ml) or DMSO (5 mg/ml). Dissolve in a minimal amount of DMF or DMSO then add H_2O, buffer or medium just prior to use.	03-34-0051-5MG	19,900
						03-34-0051-25MG	51,900
						03-34-0051-100MG	139,000
(Benzyloxycarbonylleucyl-norleucinal)	細胞膜透過性のカルパイン阻害剤 (ID_{50} = 52 nM for calpain I; ID_{50} = 34 nM for calpain II; ID_{50} = 138 nM for papain)。分化中の PC12 細胞における神経突起伸展を促進します。血小板におけるアクチン結合タンパク質および P_{235} の Ca^{2+} イオノフォア誘発分解を抑制します。コラーゲン、イオノマイシン、またはトロンビンによる刺激を受けた血小板において、ミオシン軽鎖のリン酸化を阻害します。また、エストロゲン受容体陽性乳がん細胞の増殖を阻害します。						
ALLN	110044-82-1	383.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	208719-5MG	12,900
						208719-25MG	33,000
(Calpain Inhibitor I; LLNL; MG 101)	カルパイン I (K_i= 190 nM)、カルパイン II (K_i= 220 nM)、カテプシン B (K_i= 150 nM)、およびカテプシン L (K_i= 500 pM) の阻害剤。中性システインプロテアーゼおよびプロテアソームを阻害します (K_i= 6 μM)。低酸素および虚血によって誘発されたニューロン損傷に対する保護作用を示します。胸腺細胞および後骨髄球におけるアポトーシスを阻害します。また、L929 細胞におけるレオウイルス誘導性アポトーシスも阻害します。ユビキチン・プロテアソーム複合体による IκB-α および IκB-β のタンパク質分解を阻害します。サイクリン B 分解を阻害することによって、CHO 細胞における G_1/S 期および中期 / 後期での細胞周期進行を阻害します。また、誘導型一酸化窒素合成酵素遺伝子の転写を阻害することによって、活性化マクロファージによる一酸化窒素産生を抑制します。						
ALLM	110115-07-6	401.6	> 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml), Ethanol (5 mg/ml), and Methanol (5 mg/ml)	208721-25MG	46,000
(Calpain Inhibitor II)	カルパイン I (K_i= 120 nM)、カルパイン II (K_i= 230 nM)、カテプシン B (K_i= 100 nM)、およびカテプシン L (K_i= 600 pM) の阻害剤。活性化誘導性プログラム細胞死を阻害し、HIV^+ ドナーにおける免疫応答不全を回復させます。誘導型一酸化窒素合成酵素遺伝子の転写を阻害することによって、活性化マクロファージによる一酸化窒素産生を抑制します。プロテアソームの弱い阻害剤です。						
Calpain Inhibitor III	88191-84-8	382.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml). Use only anhydrous DMSO.	208722-25MG	34,900
(Carbobenzoxy-valinyl-phenylalaninal; MDL 28170)	カルパイン I および II の強力な細胞膜透過性阻害剤 (K_i= 8 nM)。培養後根神経節において、カプサイシンを介した細胞死を抑制します。単離海馬錐体ニューロンにおける A23187 誘導性の神経突起伸展抑制を阻害することが報告されています。グルタミン酸誘発毒性に対する神経保護作用を示します。						
Calpain Inhibitor IV		557.7	single spot by TLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml)	208724-1MG	50,900
(Z-LLY-FMK)	カルパイン II に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤 (k_2 = 28,900 $M^{-1}s^{-1}$)。カテプシン L の阻害剤としても作用します (k_2 = 680,000 $M^{-1}s^{-1}$)。						
Calpain Inhibitor V		407.5	single spot by TLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml)	208726-1MG	50,900
(Mu-Val-HPh-FMK)	カルパインに対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤です。						
Calpain Inhibitor XI		504.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	208743-1MG	24,900
						208743-5MG	81,000
[Z-L-Abu-CONH$(CH_2)_3$-morpholine]	細胞透過性のジペプチジル α- ケトアミドで強力で可逆的な、高い選択性を示す calpain-1 と -2 の阻害剤 (それぞれ K_i= 140 nM and 41 nM)。cathepsin B を弱く阻害する (K_i= 6.9 μM)。 また、中枢神経系の focal ischemia 後の神経保護作用を示します。マウスにおいてウィルス性のアポトーシス性心筋障害の保護作用が報告されています。						
Calpain Inhibitor VI		372.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	208745-1MG	15,900
						208745-5MG	50,000
[*N*-(4-Fluorophenylsulfonyl)-L-valyl-L-leucinal; SJA6017]	カルパインに対する、強力かつ細胞膜透過性を有する可逆的阻害剤です (IC_{50} = 80 nM)。培養水晶体において、A23187 誘導性の核混濁ならびにクリスタリンおよび α- スペクトリンのタンパク質分解を抑制します。						
InSolution™ ALLN	110044-82-1	383.5	single spot by TLC	-20℃		208750-5MG	17,000
(Calpain Inhibitor I; LLNL; MG 101)	DMSO に ALLN (製品番号 208719) の 10 mM (5 mg/1.30 ml) 溶液。						
Calpastatin Peptide		3177.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml) or 1% Acetic Acid (1 mg/ml)	208902-500UG	36,900
(CS Peptide)	ヒトカルパスタチンのエクソン 1B によってコードされている、27 アミノ酸残基の細胞膜透過性ペプチドです。カルパイン I およびカルパイン II の強力な阻害剤として作用します (精製ウサギ calpain II に対し IC_{50} = 20 nM)。パパインおよびトリプシンに対しては阻害作用を示しません。甲状腺刺激ホルモン放出ホルモン (TRH) による刺激を受けたラット下垂体 GH_4C_1 細胞において、プロテインキナーゼ $C_ε$ ($PKC_ε$) のダウンレギュレーションをブロックします。						
Calpastatin Peptide, Negative Control		3177.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO or H_2O (20 mg/ml)	208904-500UG	37,900
	Calpastatin Peptide (製品番号 208902) と同一のアミノ酸組成を有するスクランブルペプチド。Calpastatin Peptide のネガティブコントロールとして有用です。						
EST	88321-09-9	342.4	≥ 98% by TLC	-20℃	Chloroform or Ethanol	330005-1MG	26,900
[E-64d; (2S,3S)-*trans*-Epoxysuccinyl-L-leucylamido-3-methylbutane Ethyl Ester; Loxistatin]	細胞膜透過性を有する不可逆的システインプロテアーゼ阻害剤。E-64 (製品番号 324890) に類似していますが、荷電基を持っていません。EST の阻害活性は、このエステルの *in vitro* 加水分解によって生成する遊離酸である E-64c に起因するものと考えられています。カルパイン I の活性化を阻害することが報告されています。筋ジストロフィーの動物モデルにおいて使用されています。						
PD 150606		306.1	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) or Methanol (25 mg/ml)	513022-5MG	25,900
[3-(4-Iodophenyl)-2-mercapto-(Z)-2-propenoic Acid]	カルパインのカルシウム結合部位に作用する細胞浸透性、非競合的、選択的な非ペプチド性カルパイン阻害剤 [μ- カルパイン (カルパイン I; 製品番号 208712 および 208713) については K_i= 210 nM、m-calpain (カルパイン II; 製品番号 208715 および 208718) については 370 nM]。カテプシン B やカテプシン L などの他のプロテアーゼに比べ、カルパインに対し高い特異性を示します。活性部位阻害剤のトランス -(エポキシスクシニル) -L- ロイシル - アミド -3- メチルブタンによる失活からは、カルパインを阻害しません。報告によると、胸腺細胞のデキサメタゾン誘導性アポトーシスを妨げます。						

プロテアーゼ阻害剤

Collagenase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Collagenase Inhibitor I		448.5	≥ 98% by TLC	-20℃	Ethanol (5 mg/ml)	234140-5MG	15,900
(Z-PDLDA-NHOH)	脊椎動物コラゲナーゼに対する、強力かつ特異的な阻害剤です。IC_{50} は μM レベルです。						
TAPI-0	143457-40-3	456.5	≥ 96% by HPLC	-20℃	50% acetic acid (1 mg/ml) or DMSO (5 mg/ml)	579050-1MG	24,000
{N-(R)-[2-(Hydroxyaminocarbonyl) methyl]-4-methylpentanoyl-L-naphthylalanyl-L-alanine Amide; TNF-α Protease Inhibitor-0}	コラゲナーゼ、ゼラチナーゼ、および TACE (TNF-α 変換酵素 /ADAM17; IC_{50} = 100 nM) のヒドロキサム酸型阻害剤。トランスフェクトされた COS 7 細胞における TNF-α の自然放出および PMA 誘導放出を抑制します。						
TAPI-1		499.6	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or Methanol (1 mg/ml)	579051-1MG	73,900
{N-(R)-[2-(Hydroxyaminocarbonyl) methyl]-4-methylpentanoyl-L-naphthylalanyl-L-alanine, 2-aminoethyl Amide; TNF-α Protease Inhibitor-1}	TAPI-0 (製品番号 579050) の構造アナログ。*in vitro* で TAPI-0 と同程度の MMP および TACE (TNF-α 変換酵素 /ADAM17) の阻害作用を示します。また、TAPI-1 は、IL-6 受容体、p60 TNF 受容体、p80 TNF 受容体などの様々な細胞表面タンパク質のシェディングを抑制します。M_3 ムスカリン受容体を過剰発現している HEK293 細胞において、構成性 (IC_{50} = 8.09 μM) およびムスカリン受容体誘導性 (IC_{50} = 3.61 μM) の sAAPα 放出を抑制します。						
TAPI-2		415.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	Ethanol (5 mg/ml) or H_2O (5 mg/ml)	579052-1MG	72,900
{N-(R)-[2-(Hydroxyaminocarbonyl) methyl]-4-methylpentanoyl-L-*t*-butyl-alanyl-L-alanine, 2-aminoethyl Amide; TNF-α Protease Inhibitor-2}	MMP および TACE のヒドロキサム酸型阻害剤。好中球、好酸球、およびリンパ球からの L- セレクチンの活性化誘導シェディングを抑制し、好中球におけるフェニルアルシンオキシド (PAO) 誘導シェディングも抑制します。アンジオテンシン変換酵素の弱い阻害剤としても作用します (IC_{50} = 18 μM)。						
InSolution™ TAPI-1		499.6	≥ 97% by HPLC	-20℃		579053-500UG	40,900
	TAPI-1 (製品番号 579051) の 10 mM (500 μg/100 μl) DMSO 溶液です。						

Elastase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
α1-Antitrypsin, Human Plasma	9041-92-3	52000	≥ 95% by SDS-PAGE	-20℃	H_2O. Please refer to vial label for lot-specific volume prior to lyophilization.	178251-1MG 178251-5MG	20,000 60,000
($α_1$-AT; 3.5S $α_1$-Glycoprotein; $α_1$-Proteinase Inhibitor)	アスパラギン残基に結合した 3 つの炭化水素側鎖を有する、394 アミノ酸残基からなる一本鎖ポリペプチド。急性期血漿中に約 290 mg/100 ml の濃度で存在します。セリンプロテアーゼ阻害剤であり、エラスターゼの重要な生理調節因子としても作用します。好中球エラスターゼ、カテプシン G、およびプロテイナーゼ 3 の阻害剤です。						
Elastase Inhibitor I		450.5	>90% by HPLC	room temp.	Acetonitrile, DMSO (5 mg/ml) , or Ethanol	324692-1MG	25,000
(Boc-AAA-NHO-Bz; PPE Inhibitor)	セリンプロテアーゼ阻害剤。ブタ膵臓エラスターゼ (PPE; k_i= 128 M^{-1} sec^{-1}) および thermitase (k_i= 1.14 x 10^3 M^{-1} sec^{-1}) を阻害します。						
Elastase Inhibitor II		474.9	≥ 99% by TLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol	324744-5MG	27,000
(HNE Inhibitor; MeOSuc-AAPA-CMK; MSACK)	ヒト好中球エラスターゼ (HNE) の強力な不可逆的阻害剤です。						
Elastase Inhibitor III		503	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol	324745-5MG	28,000
(HLE Inhibitor; MeOSuc-AAPV-CMK)	ヒト白血球エラスターゼ (HLE) の強力な不可逆的阻害剤。エラスターゼ点滴によって誘発される肺損傷に対する保護作用を示します。						
Elastase Inhibitor IV	127373-66-4	434.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	324759-1MG	19,900
[N-(2-(4-(2,2-Dimethylpropionyloxy) phenylsulfonylamino) benzoyl) aminoacetic acid; N-(o-(*p*-Pivaloyloxybenzene) sulfonylaminobenzoyl) glycine]	好中球エラスターゼの強力、基質競合的かつ非常に特異的な阻害剤として働く細胞透過性のスルファニリド化合物 (ラット、ウサギ、ハムスター、ヒトおよびマウス白血球エラスターゼを用いた場合、IC_{50} = 19-49 nM)。膵臓エラスターゼ (IC_{50} = 5.6 μM) に対するよりも 100 倍以上の選択性を示し、トリプシン、トロンビン、プラスミン、カリクレイン、キモトリプシンおよびカテプシン G に対しては 100 μM もの高濃度でも不活性です。*in vivo* においてヒト好中球が誘導する肺出血および皮膚の毛細管透過性を効果的に抑制します。また、マスト細胞 Stat6 プロテアーゼを阻害することが報告されています。						

Furin 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
ADAMTS-5 Inhibitor		449.9	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	114810-5MG	41,000
[Aggrecanase-2 Inhibitor; 5-((4-Chlorobenzylthio-3-trifluoromethyl-N-methyl-1H-pyrazol-4-yl) methylene)-2-thioxothiazolidin-4-one]	チオキソチアゾリジノン化合物。活性部位 Zn^{2+} キレート ADAMTS-5 (A Disintegrin-like And Metalloprotease with ThromboSpondin type 1 motif、5) 選択的阻害剤として作用します (ADAMTS-5 および ADAMTS-4 に対してそれぞれ IC_{50} = 1.1 μM および 44.0 μM)。						
CL-82198		338.8	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (25 mg/ml)	233105-5MG	27,000
	MMP-13 の選択的阻害剤 (IC_{50} =10 μM)。MMP-1、MMP-9、および TACE に対しては阻害作用を示しません。						
Doxycycline, Hydrochloride	24390-14-5	512.9	≥ 95% by TLC	+4℃	H_2O (50 mg/ml)	324385-1GM	11,900
(-6-Deoxy-5-hydroxytetracycline; Vibramycin, Hyclate)	広く使用されている、抗菌スペクトルの広い抗生物質です。MMP-1 (間質コラゲナーゼ ; IC_{50} = 300 μM) より MMP-8 (好中球コラゲナーゼ ; IC_{50} = 30 μM) を強力に阻害します。また、アルジネート中で培養したウシ関節軟骨細胞によるコラーゲン合成を阻害します (IC_{50} = 25 μM)。IL-10 放出には影響を及ぼさずに LPS 活性化マクロファージによる一酸化窒素合成を阻害します。						
Furin Inhibitor I		744.4	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO or Methanol (1 mg/ml)	344930-1MG	23,000
(Decanoyl-RVKR-CMK)	フリンの触媒座位に結合してその活性を遮断するペプチジルクロロメチルケトン。この性質により、ウイルス糖タンパク質を高い特異性で開裂して阻害し、ウイルス複製を遮断する物質としての使用が可能となります。フリンによる MT5-MMP の切断を阻害し、MT5-MMP の活性化を阻止することが報告されています。また、BACE (- 座位 APP 開裂酵素) によるプロペプチドの開裂を抑制することも示されています。						
Furin Inhibitor II		954.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO or H_2O (1 mg/ml)	344931-1MG	25,900
[Hexa-D-arginine; H-(D) RRRRRR-NH_2]	ポリ D- アルギニン化合物で、強力で選択的、競合的なフリン阻害剤 (K_i = 106 nM)。また高濃度ではサチライシン様前駆タンパク質転換酵素 4 (PACE4) (K_i = 580 nM) およびプロホルモン転換酵素 1 (PC1) (K_i = 13 μM) も阻害します。プロホルモン転換酵素 2 (PC2) 活性に対しては、促進作用をもちます。D 型アミノ酸ペプチドの方が、L 型ペプチドよりも *in vivo* での分解に耐性をもっています。 H-(D) Arg-Arg-Arg-Arg-Arg-Arg-NH_2						

プロテアーゼ阻害剤

Furin 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
GM 1489	170905-75-6	463.6	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml)	364200-1MG	18,900
						364200-5MG	53,000
{N-[(2R)-2-(Carboxymethyl)-4-methylpentanoyl]-L-tryptophan-(S)-methyl-benzylamide}	広汎なマトリクスメタロプロテイナーゼ (MMP) に対する阻害剤。*in vitro* で MMP を阻害します (MMP-1 について K_i= 0.2 nM; MMP-2 について 500 nM; MMP-3 について 20 µM; MMP-8 について 100 nM; MMP-9 について 100 nM)。また、フォルボールエステルの局所適用により生じる炎症反応および過剰増殖反応も抑制します。						
GM 6001	142880-36-2	388.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	364205-1MG	17,900
						364205-5MG	52,900
{Galardin; N-[(2R)-2-(Hydroxamidocarbonylmethyl)-4-methylpentanoyl]-L-tryptophan Methylamide}	マトリクスメタロプロテイナーゼ (MMP) の強力な広域スペクトルヒドロキサム酸阻害剤。*in vitro* で MMP を阻害します (MMP-1 について K_i= 400 pM; MMP-2 について 500 pM; MMP-3 について 27 nM; MMP-8 について 100 pM; MMP-9 について 200 pM)。また、マウスに対し、*in vitro* および *in vitro* での TNF-α 放出を抑制し、エンドトキシンの誘導による致死性を阻害します。						
InSolution™ GM6001		388.5	≥ 95% by HPLC	+4℃		364206-1MG	18,900
	DMSO に GM6001 (製品番号 364205) の 10 mM (1 mg/257 µl) 溶液。						
GM 6001, Negative Control		430.5	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	364210-1MG	18,900
						364210-5MG	53,900
(N-*t*-Butoxycarbonyl-L-leucyl-L-tryptophan Methylamide)	MMP 阻害剤である GM 6001 (製品番号 364205) のネガティブコントロールとして有用です。						
DL-Thiorphan	76721-89-6	253.3	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or ethanol (10 mg/ml)	598510-10MG	50,900
{N-[(RS)-2-Benzyl-3-mercaptopropanoyl]-glycine}	チオール基をもつアミノ酸。メタロプロテイナーゼの活性部位亜鉛に選択的に結合し、酵素活性を阻害します [IC_{50} = 2.1 nM (中性エンドペプチダーゼ -NEP)]。*in vitro* で Aβ 分解酵素 neprilysin の活性を阻害することが明らかになっていますが、Aβ ペプチドおよびアミロイド β 前駆体タンパク質 (APP) の分泌には影響を与えません。また、極めて高濃度ではアンジオテンシン変換酵素 (ACE) の活性を阻害することが明らかになっています (IC_{50} = 14 µM)。エンドセリン変換酵素の活性には影響を与えません。						

Matrix Metalloproteinase (MMP) 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Batimastat	130370-60-4	477.6	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO	196440-5MG	28,900
MMP-3 Inhibitor I		686.8	≥ 90% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	444218-5MG	52,000
(Ac-RCGVPD-NH_2; Stromelysin-1 Inhibitor)	マトリクスメタロプロテイナーゼ MMP-3 を阻害します (IC_{50} = 5 µM)。						
MMP-3 Inhibitor II		316.4	≥ 98% by TLC	room temp.	DMSO (30 mg/ml) or Ethanol (8 mg/ml)	444225-5MG	24,000
[N-Isobutyl-N-(4-methoxyphenylsulfonyl)-glycylhydroxamic Acid; NNGH]	ヒト MMP-3 の強力な阻害剤 (K_i= 130 nM)。						
MMP-8 Inhibitor I		362.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml)	444237-1MG	23,900
{(3R)-(+)-[2-(4-Methoxybenzenesulfonyl)-1,2,3,4-tetrahydroisoquinoline-3-hydroxamate]}	MMP-8 の強力な阻害剤 (IC_{50} = 4 nM)。						
MMP-2/MMP-9 Inhibitor I		381.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml)	444241-5MG	40,900
{(2R)-2-[(4-Biphenylylsulfonyl)amino]-3-phenylpropionic Acid}	MMP-2 (IC_{50} = 310 nM) および MMP-9 (IC_{50} = 240 nM) の強力な阻害剤。						
MMP-2 Inhibitor I	10335-69-0	297.5	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO (2 mg/ml) or Ethanol (3 mg/ml)	444244-10MG	19,900
(OA-Hy; *cis*-9-Octadecenoyl-N-hydroxylamide; Oleoyl-N-hydroxylamide)	MMP-2 の強力な阻害剤として、用量依存的に作用します (K_i= 1.7 µM)。						
MMP Inhibitor II	203915-59-7	513.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) . Requires vigorous vortexing for 60 seconds to completely solubilize the product.	444247-1MG	31,900
[N-Hydroxy-1,3-di-(4-methoxybenzenesulphonyl)-5,5-dimethyl-[1,3]-piperazine-2-carboxamide]	MMP-1 (IC_{50} = 24 nM)、MMP-3 (IC_{50} = 18.4 nM)、MMP-7 (IC_{50} = 30 nM) および MMP-9 (IC_{50} = 2.7 nM) の強力な阻害剤。						
MMP-2/MMP-9 Inhibitor II		396.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) or Methanol (25 mg/ml)	444249-1MG	31,900
{(2R)-[(4-Biphenylylsulfonyl)amino]-N-hydroxy-3-phenylpropionamide; BiPS; BiPS}	MMP-2 (IC_{50} = 17 nM) および MMP-9 (IC_{50} = 30 nM) の強力な阻害剤。						
MMP Inhibitor I		490.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	444250-10MG	37,000
(FN-439)	ヒトマトリクスメタロプロテイナーゼ阻害剤。MMP-1 および MMP-8 (IC_{50} = 1.0 µM)、MMP-9 (IC_{50} = 30 µM) および MMP-3 (IC_{50} = 150 µM) を阻害します。PRONASE Protease (製品番号 53702 あるいは 537088) あるいはヒト顆粒球エラスターゼと共に長時間インキュベーションしてもその活性を維持します。						
MMP-2/MMP-9 Inhibitor III		1166.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (5 mg/ml)	444251-1MG	37,900
	MMP-2 の強力な阻害剤として作用する疎水性環状ペプチド (IC_{50} = 10 µM)。ヒト内皮細胞および腫瘍細胞の遊走を阻害し、動物モデルにおける腫瘍の成長および浸潤を阻害します。また、このペプチドを呈するファージは、*in vivo* で血管新生の途上にある血管を標的とします。						
MMP-9/MMP-13 Inhibitor I		495.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) or Methanol (1 mg/ml)	444252-1MG	24,900
[N-Hydroxy-1-(4-methoxyphenyl)sulfonyl-4-(4-biphenylcarbonyl)piperazine-2-carboxamide]	ピペラジン骨格をもつ MMP-9 (IC_{50} = 900 pM) および MMP-13 (IC_{50} = 900 pM) の強力な阻害剤。より高濃度では MMP-1 および MMP-3 を阻害します (それぞれ IC_{50} = 43 nM および 23 nM)。また MMP-7 の阻害剤としても作用します (IC_{50} = 930 nM)。						

Matrix Metalloproteinase（MMP）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
MMP Inhibitor III		363.5	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	444264-1MG	31,000
	MMP-1（IC_{50} = 4 nM）、MMP-2（IC_{50} = 2.3 nM）、MMP-3（IC_{50} = 135 nM）、MMP-7（IC_{50} = 10-100 nM）および MMP-13（IC_{50} = 1-10 nM）の広スペクトル MMP 阻害剤。						
MMP-2/MMP-9 Inhibitor IV		306.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）	444274-500UG	35,000
（SB-3CT）	ヒトゼラチナーゼ MMP-2（K_i= 13.9 nM）および MMP-9（K_i= 600 nM）に対する、強力で、選択的で、結合速度の低い、機序に基づいて作用する阻害剤。結合速度の低い阻害成分が、TIMP-1 および TIMP-2 とほぼ同じ挙動を示し、また、これらの酵素の阻害においては、共有結合機序に基づく挙動も示します。						
MMP-9 Inhibitor I		511.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	444278-500UG	22,000
	MMP-9 の強力かつ選択的な阻害剤（IC_{50} = 5 nM）。MMP-1（IC_{50} = 1.05 μM）と MMP-13（IC_{50} = 113 nM）は、はるかに高い濃度でのみ阻害します。						
MMP-13 Inhibitor	544678-85-5	410.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）. Further dilute in buffer immediately prior to use.	444283-1MG	26,900
[Pyrimidine-4,6-dicarboxylic acid, *bis*-(4-fluoro-3-methyl-benzylamide)]	MMP-13 活性を強力に阻害するピリミジンジカルボキシアミド化合物（IC_{50} = 8 nM）。立体構造解析の結果から判断して、MMP-1,-2,-3,-7,-8,-9,-10,-12,-14 および -16 には影響しない選択性をもつことが予想されます。MMP-13 の触媒ドメインに結合し、非 Zn キレート阻害剤として作用することが示されています。						
MMP-2/MMP-3 Inhibitor III, PD166793	199850-67-4	412.3	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO（40 mg/ml）or Ethanol（40 mg/ml）	444284-5MG	32,000
[(S)-2-(4-Bromo-biphenyl-4-sulfonylamino-3-methylbutyric acid)]	細胞透過性のビフェニルスルフォニルバリン化合物。MMP-2,-3 および -13 に対する強力な阻害剤として作用し（それぞれ IC_{50} = 47, 12 および 8 nM）、AMP デアミナーゼ（0.1 μM で 20% の阻害）、MMP-1,-7,-9 および -14 に対しては弱い阻害剤として作用します（それぞれ ,IC_{50} = 6.1, 7.2, 7.9 および 0.24 μM）。心不全および糖尿病のさまざまな *in vivo* 動物モデルにおいて、治療効果をもたらすことが示されています。						
MMP-2/MMP-9 Inhibitor V		399.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	444285-500UG	39,900
[(4-(4-(Methanesulfonamido) phenoxy) phenylsulfonyl) methylthiirane; SB-3CT, *p*MS]	細胞透過性を有する SB-3CT（製品番号 444274）のスルフォンアミドアナログです。水溶性が向上し、選択性が向上しています [K_i = 16 nM（MMP-2）、180 nM（MMP-9）、900 nM（MMP-14）]。他の MMP にはほとんど阻害作用を示しません [K_i = 3.6 μM（MMP-3）、295 μM（MMP-7）、>>25 μM（MMP-1）]。活性中心に結合してブロックし、不可逆的 MMP 阻害剤として作用します。また、HT1080 の細胞遊走および浸潤を強力に抑制し（2 μM で 80% 抑制、100 nM で > 25% 抑制）、MMP-14 を過剰発現した BS-C-1 細胞において、4 μM までの濃度で pro-MMP-2 を活性化しません。						
MMP-2 Inhibitor II		383.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	444286-5MG	41,000
[(4-(4-(Methanesulfonamido) phenoxy) phenylsulfonyl) methyloxirane]	SB-3CT、pMS（製品番号 444285）のオキシランアナログ。MMP-2 の活性中心に結合してブロックし、選択的な不可逆的 MMP-2 阻害剤として作用します（K_i = 2.4 μM）。MMP-1（K_i = 45 μM）および MMP-7（K_i = 379 μM）をある程度抑制しますが、他の MMP に対してはほとんど作用を示しません。						
MMP-2 Inhibitor III	704888-90-4	364.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（200 mg/ml）or Methanol（100 mg/ml）	444288-5MG	45,900
[(2-((Isopropoxy)-(1,1-biphenyl-4-ylsulfonyl) -amino))-N-hydroxyacetamide]	細胞透過性のビフェニルスルフォンアミドヒドロオキサメート化合物。MMP-2 の Zn^{2+} 結合部位を標的とした強力な阻害剤として作用します（IC_{50} = 12 nM）。優れた選択性を有しており、MMP-9 および MMP-3 への影響は低く（それぞれ IC_{50} = 0.2 および 4.5 μM）、MMP-1 と MMP-7 には現実的にまったく影響を与えません（IC_{50} > 50 μM）。マトリゲル上で培養した HT1080 肉腫細胞の侵襲性を効果的に抑制することが示されています。						
MMP Inhibitor V	223472-31-9	446.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（30 mg/ml）or Ethanol（15 mg/ml）	444290-2MG	28,900
(2S,4S)-N-Hydroxy-5-ethoxymethyloxy-2-methyl-4-(4-phenoxybenzoyl) aminopentanamide	経口活性のある非ペプチジルヒドロキサム酸化合物。強力かつ可逆的な活性部位亜鉛結合 MMP 阻害剤として作用し（MMP-2,-3,-7,-8,-9,-12,-13 に対する K_i= 0.73 nM、42 nM、2.5 μM、1.1 nM、2.1 nM、0.45 nM、1.1 nM）、他のプロテアーゼに対するより高い選択性を示します。虚血再灌流障害を抑制し、腫瘍成長を阻害することが報告されています。						
MMP-12 Inhibitor, MMP408	58003-93-8	420.4	≥ 94% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml）	444291-5MG	25,900
(*S*)-2-(8-(Methoxycarbonylamino) dibenzo[b,d] furan-3-sulfonamido)-3-methylbutanoic acid	ジベンゾフラニルスルファンアミドバリン化合物。強力で活性部位の亜鉛を作用標的とする MMP-12 の選択的阻害剤（ヒト MMP-12 に対する IC_{50} = 2 nM）として作用し、マウス / ラット / ヒツジ MMP-12（IC_{50} はそれぞれ 160、320、および 22.3 nM）やヒト MMP-3/13/14（IC_{50} はそれぞれ 351、120、および 1100 nM）に対する活性ははるかに弱く、ヒト Agg-1/2（IC_{50} > 5 μM）、TACE（IC_{50} > 25 μM）、および MMP-1/7（IC_{50} > 6 μM）に対してはほとんど効果はありません。MMP408 はマウスに対し経口投与可能で、*in vivo* マウスにおいて rhMMP-12 誘発肺炎症反応を 50% 以上効果的に軽減することが判明しています（5 mg/kg、1 日 2 回経口投与）。						
Minocycline, Hydrochloride	13614-98-7	493.9	≥ 98% by TLC	+4℃	H_2O（50 mg/ml）	475843-50MG	12,000
(7-Dimethylamino-6-demethyl-6-deoxytetracycline, HCl)	テトラサイクリン耐性ブドウ球菌に効果を示す半合成テトラサイクリン誘導体。腫瘍誘導性血管新生を阻害することが示されているマトリクスメタロプロテイナーゼ（MMP）阻害剤です。ストロメリシン（MMP-3）を阻害しますが（IC_{50} = 290 μM）、線維芽細胞コラゲナーゼあるいはゼラチナーゼなどの他の MMP は阻害しません。抗炎症作用を示し、T 細胞増殖を抑制します。						

プロテアーゼ阻害剤

Plasminogen Activator 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Plasminogen Activator Inhibitor-1, Human, Recombinant		43000	≥ 98% by SDS-PAGE	-70℃		528205-50UG	53,000
(PAI-1)	急性心筋梗塞のマーカーとして、また一部の溶血疾患の診断に使用されています。血小板を血漿の阻害作用より保護します。乳がん患者の重要な予後因子であると報告されています。PAI-1 は組織プラスミノーゲンアクチベーター（tPA）およびウロキナーゼ（uPA）の両者に対して一次的阻害物質となります。PAI-1 は活性阻害型コンフォメーションあるいは不活性型（潜伏型）コンフォメーションとして存在します。本品は高純度標本であり、変性条件に曝露していません。クロマトグラフィにより潜伏型コンフォメーションを除去しています。PAI-1 は pH 6.6 以下で保存すると高い安定性を示します。						
Plasminogen Activator Inhibitor-1, Mutant, Human, Recombinant		43000	≥ 95% by SDS-PAGE assay	-70℃		528208-50UG	51,000
Plasminogen Activator Inhibitor-1, Mutant, Human, Recombinant	4 つのアミノ酸変異を有する変異型ヒト PAI-1 を高度に精製した標本。変異型 PAI-1 は潜伏型を取ることがほとんどありません。また高温、高 pH で長期間安定です（37℃、pH 7.4 で $t_{1/2}$ = 145 時間）。uPA（K_i= 5.1 x 10^6 M^{-1} sec^{-1}）および tPA（K_i= 7.9 x 10^5 M^{-1} sec^{-1}）を阻害します。						
Plasminogen Activator Inhibitor-1, Mutant, Mouse, Recombinant		43000	> 95% by SDS-PAGE	-70℃		528213-50UG	51,000
(PAI-1)	本品のアミノ酸配列は 1 ヶ所（Ile^{91} → Leu^{91}）のみ置換されています。この置換により半減期が延長されています（天然組換え型の約 4 倍）。pH 6.6 以下で安定的に保存できます。安定性は良好です（25℃、pH 7.4 で $t_{1/2}$ = 8-9 時間）。						

Tissue Inhibitor of Matrix Metalloproteinases（TIMP）

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
TIMP-1, Human Neutrophil Granulocyte		28000	≥ 90% by SDS-PAGE	-70℃		612080-5UG	62,000
(Tissue Inhibitor of Metalloproteinase-1)	MMP 活性の活性化と調節に関与するインヒビターのファミリーに属しています。潜在性および活性の MMP と非共有結合的に化学量論的複合体を形成します。C 末端ドメインを介して、pro-MMP-9 および MMP-9 に結合します。						
TIMP-2, Human Rheumatoid Synovial Fibroblast		24000	≥ 90% by SDS-PAGE	-70℃		612084-5UG	62,000
(Tissue Inhibitor of Metalloproteinase-2)	MMP 活性の活性化と調節に関与するインヒビターのファミリーに属しています。潜在性および活性の MMP と非共有結合的に化学量論的複合体を形成します。MMP-1、MMP-2、MMP-12 およびトランシンの活性を阻害することが示されています。						

プロテアソーム / ユビキチン化阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
AdaAhx3L3VS		932.6	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	114802-250UG	53,900
[Adamantane-acetyl-(6-aminohexanoyl)$_3$-(leucinyl)$_3$-vinyl-(methyl)-sulfone]	20S プロテアソームのトリプシン様活性（IC_{50} = 1.0 - 5.0 μM）や、キモトリプシン様活性（IC_{50} = 0.05 - 0.01 μM）、PGPH 活性（IC_{50} = 0.5 - 1.0 μM）を共有結合で不可逆的に阻害します。						
Anaphase-Promoting ComplexInhibitor, TAAME	1784-03-8	378.87	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	172104-50MG	30,900
Celastrol, *Celastrus scandens*	34157-83-0	450.6	≥ 95% by TLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）or Ethanol	219465-10MG	36,900
[3-Hydroxy-24-nor-2-oxo-1(10),3,5,7-friedelatetraen-29-oic Acid; Tripterin]	細胞透過性のジエノン - フェノール性トリテルペン化合物で抗酸化剤、抗炎症剤作用を持ちます。LPS 刺激によるマクロファージ・単球の炎症性サイトカインの放出を抑制します（IC_{50} = 40 nM for IL-1β and IL-1α、80 nM for IL-6、110 nM for PGE_2、and 210 nM for IL-8 and TNF-α）。また RAW264.7 細胞において LPS 誘導による NF-κB 活性化阻害（IC_{50} = 270 nM）、NO 産生阻害（IC_{50} = 230 nM）を示し、ラット肝ミトコンドリアの ADP と Fe^{2+} による脂質の過酸化を阻害します（IC_{50} = 7 μM）。ラットでは記憶・学習・心理動活性を顕著に改善することが知られており、アルツハイマー症（AD）における炎症抑制効果が期待されています。						
Epoxomicin, Synthetic		554.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（1 mg/ml）or Methanol（1 mg/ml）	324800-100UG	48,900
	抗腫瘍作用および抗炎症作用を有します。プロテアソームのキモトリプシン様（CT-L）活性、トリプシン様（T-L）活性、およびペプチジルグルタミルペプチド加水分解（PGPH）活性に対して、強力かつ特異性の高い不可逆的阻害作用を示します。プロテアソームの触媒サブユニット LMP-7、MECL1、および Z を修飾します。トリプシン、カテプシン B、キモトリプシンなどの非プロテアソームプロテアーゼの活性に対しては作用を及ぼしません。						
InSolution™ Epoxomicin, Synthetic		554.7	≥ 95% by HPLC	-20℃		324801-50UG	30,900
	DMSO に合成エポキソミシンの 1 mM（50 μg/90 μl）溶液。						
Hdm2 E3 Ligase Inhibitor		350.2	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	373225-5MG	20,000
[N-((3,3,3-Trifluoro-2-trifluromethyl)propionyl)sulfanilamide]	細胞透過性のベンズ - スルホンアミド化合物。hdm2 E3 リガーゼ活性を可逆的に阻害し、hdm2 による p53 のユビキチン化を選択的に抑制します（Ub-Ubc4 を供与体基質として用いた場合の IC_{50} = 12.7 μM）。他のユビキチン関連酵素 [IC_{50} > 100 μM（E1、Nedd-4、および SCF）] および Hdm2 の自己ユビキチン化活性に対してはほとんど作用を示しません。阻害作用は、供与体基質とも受容体基質とも競合しません。						
Lactacystin, Synthetic	1258004-00-0	376.4		-20℃	DMSO（50 mg/ml）or H_2O	426100-200UG 426100-400UG 426100-1MG	27,000 52,000 180,000
	不可逆的プロテアソーム阻害剤。20S プロテアソーム（MCP; 多触媒性プロテイナーゼ複合体）の高特異性阻害剤として作用する *Streptomyces* 属の代謝物です。触媒 β サブユニットを標的としてプロテアソーム活性を遮断します。プロテアソームのキモトリプシンおよびトリプシン様活性の共有結合的阻害剤として作用します。Neuro 2A マウス神経芽腫細胞の神経突起発芽を誘導し、Neuro 2A 細胞と MG-63 ヒト骨肉腫細胞の同調培養において、細胞周期を G_1 期で停止させます。ヒト単芽球 U937 細胞のアポトーシスを誘導することが報告されています。また NF-κB の活性化も阻害します（IC_{50} = 10 μM）。						

プロテアソーム / ユビキチン化阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
clasto-Lactacystin β-Lactone	154226-60-5	213.2		-20℃	DMSO (3 mg/ml)	426102-100UG	43,000
(Omuralide)	特異性が高く、細胞浸透性の不可逆的プロテアソーム阻害剤。天然の Lactacystin (製品番号 426100) は *in vitro* で *clasto*-lactacystin β-lactone の前駆体として作用すると考えられています。また *clasto*-lactacystin β-lactone はプロテアソームと相互作用する唯一の分子種と考えられています。						
MG-115		461.6	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	474780-5MG	40,000
(Carbobenzoxy-L-leucyl-L-leucyl-L-norvalinal; Z-LL-Nva-CHO)	プロテアソームの強力かつ可逆的な阻害剤 (20S および 26S プロテアソームに対して、それぞれ K_i= 21 nM および 35 nM)。プロテアソームのキモトリプシン様活性を特異的に阻害し、Rat-1 および PC12 細胞のアポトーシスを誘導します。						
MG-132, ≥ 95% by HPLC	133407-82-6	475.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO or EtOH	474787-10MG	18,900
InSolution™ MG-132 in EtOH, =<95% by HPLC		475.6	≥ 95% by HPLC	-70℃		474788-10MG	44,900
MG-132	133407-82-6	475.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (20 mg/ml) or Ethanol (20 mg/ml)	474790-1MG 474790-5MG 474790-10MG 474790-20MG	7,000 22,000 33,900 50,900
(Carbobenzoxy-L-leucyl-L-leucyl-L-norvalinal; Z-LL-Nva-CHO)	強力、可逆的かつ細胞浸透性のプロテアソーム阻害剤 (K_i= 4 nM)。哺乳類細胞および酵母の浸透性株において、26S 複合体によって、ユビキチンコンジュゲートタンパク質の分解を抑制します。このとき、ATPase あるいはイソペプチダーゼ活性に影響することはありません。アポトーシスを開始させる c-Jun N- 末端キナーゼ (JNK1) を活性化します。NF-κB の活性化を阻害します (IC_{50} = 3 μM)。β- セクレターゼの開裂を阻害します。						
InSolution™ MG-132	133407-82-6	475.6	≥ 98% by HPLC	-20℃		474791-1MG 474791-5MG	11,900 37,900
(Carbobenzoxy-L-leucyl-L-leucyl-L-leucinal; Z-LLL-CHO)	DMSO に MG-132 (製品番号 474790) の 10 mM (1 mg/210 μl) 溶液。						
p97 ATPase Activity Inhibitor, DBeQ		340.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO or EtOH	506190-10MG	26,900
Proteasome Inhibitor I		618.8	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (30 mg/ml), ethanol (30 mg/ml), or methanol	539160-1MG 539160-5MG	19,000 52,000
(PSI)	HT4 細胞の多触媒性プロテイナーゼ複合体 (MCP、20S プロテアソーム) のキモトリプシン様活性を阻害する細胞浸透性の可逆性阻害物質。神経細胞内にユビキチン化タンパク質を蓄積させます。IκB-α の分解を阻害することにより TNF-α およびオカダ酸が NF-κB を活性化するのを阻害します。						
InSolution™ Proteasome Inhibitor I		618.8	≥ 90% by HPLC	-20℃		539161-5MG	53,900
(PSI)	DMSO にプロテソアーム阻害剤 (製品番号 539160) の 50 mM (5 mg/162 μl) 溶液。						
Proteasome Inhibitor II		509.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	539162-1MG 539162-5MG	18,900 50,000
[(Benzyloxycarbonyl)-Leu-Leu-phenylalaninal; Z-LLF-CHO]	細胞浸透性の強力な可逆的プロテアソーム阻害物質。下垂体多触媒性プロテイナーゼ複合体 (MPC) のキモトリプシン様活性を阻害します (K_i= 460 nM)。200 μM でも MPC のペプチジルグルタミルペプチド加水分解活性を阻害しません。また指数増殖期にある WEHI 231 細胞において IκB-α および IκB-β タンパク質の分解を阻止します。						
Proteasome Inhibitor III		491.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	539163-100UG	53,000
[Z-LLL-B(OH)$_2$; MG-262]	ホウ素酸より生成した可逆性のプロテアソーム阻害物質。MG-132 (製品番号 474790) と構造が類似していますが、はるかに高い効力を示します (MG-132 の K_i が 4 nM であるのに対し、K_i= 30 pM)。						
Proteasome Inhibitor IV		550.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	539175-5MG	45,000
(Z-GPFL-CHO)	テトラペプチドで、高選択性プロテアソーム阻害剤 (K_i= 40.5 μM でキモトリプシン様活性 ; IC_{50} = 3.1 μM でペプチジルグルタミルペプチド加水分解活性)						
Proteasome Inhibitor VIII, β-Lactam 3		260.7	≥ 95% by NMR	-70℃	DMSO (10 mg/ml)	539183-100UG	70,000
(β-Lactam 3)	20S プロテアソームの選択的かつ不可逆的な阻害剤として作用する Proteasome Inhibitor VII、Antiprotealide (製品番号 539179) の β- ラクタム類似体。プロテアソーム阻害の速度は Omuralide (製品番号 426102) よりも遅く、β-luctam 3 は水溶液中での持続的安定性を示すため、生物学的評価に非常に適しています。						
Proteasome Inhibitor XX, GL5		245.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	539185-10MG	28,000
	トリプシン、カテプシン B、MMP-2、あるいはヒト 20S プロテアソーム β1/2/5 に対してほとんど活性を示さない一方で、基質競合的、不可逆的にプロテアソーム活性 (by ~90% over 4 hours with 50 μM GL5) を選択的に阻害して、複製しないマイコバクテリウム結核 (それぞれ 50 μM DETA-NO ありまたはなしで 50 μM GL5 を 4 日間で BCG titre ~320 倍または 12,600 倍) を効果的に殺す細胞透過性チエニル - オキサチアゾロン化合物。GL5 は、マイコバクテリウム・アビウム・イントラセルラーレ、黄色ブドウ球菌、Salmonella enterica var. Typhimurium あるいは緑膿菌に対して抗菌性を示しません。GL5 は可逆的に α- キモトリプシン (K_i = 0.064 μM) を阻害することが知られていますが、ヒトやサルの細胞に対して明確な毒性は及ぼしません。GL5 は、グルタチオン (pH 7.0 時に 30 分間で 12.7%、RT; 10 μM GL5 ならびに 25 μM GSH) に対する穏やかな化学反応性にもかかわらず、RPMI 培地 ($t_{1/2}$ = 110 mins at 37° C) において比較的安定しています。						
Proteasome Inhibitor X, PI-083		439.87	>95% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml)	539187-25MG	27,000
	CT-L、T-L、PGPH-L 用のそれぞれ 1 μM、4.5 μM、4.5 μM の値 IC_{50} を持つ細胞透過性の可逆 20S プロテアソーム阻害剤。非形質転換の対応物 (T80、C7、MCF-10A) に対して卵巣がん、すい臓がん、乳がん細胞 (それぞれ T80-Hras、C7-Kras、MCF-7) において CT-L (キモトリプシン様) と細胞増殖阻害を選択的に示し、多発性骨髄腫 *in vitro* の患者から分離した骨髄細胞に関する MTT アッセイにおいて 3.7 μM の IC_{50} のアポトーシス誘発を示します。1 mpk を投与したとき、MCF-7 ならびに A549 細胞を移植したヌードマウス異種移植片モデルにおいて抗腫瘍活性を持つことを示し、84%もの著しい腫瘍増殖阻害に繋がります。PI-083 は、肝臓プロテアソーム活性を阻害せずに、未処理コントロールからそれら腫瘍と比較して、腫瘍 CT-L、T-L、PGPH 活性に対してそれぞれ 43,12,34% の阻害となりました。						

プロテアーゼ阻害剤

プロテアソーム / ユビキチン化阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Ubiquitin Aldehyde		8500	≥ 95% by HPLC	-20℃	Aqueous buffers or DMSO (50 mg/ml)	662056-50UG	39,000
	細胞内タンパク質の修飾および代謝回転の経路に関与する複数のユビキチン加水分解酵素を強力かつ特異的に阻害します。内在性または *in vitro* で合成したユビキチン - タンパク質複合体の安定化に有用です。また、ユビキチン依存性分解の速度の増減にも使用できます。						
UCH-L1 Inhibitor		397.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml)	662086-10MG	26,900
(LDN-57444; Ubiquitin C-Terminal Esterase L1 Inhibitor; Ubiquitin C-Terminal Hydrolase L1 Inhibitor; Ubiquitin Thiolesterase L1 Inhibitor)	イサチン O- アシルオキシム化合物。UCH-L1 に対する強力、可逆的かつ競合的な活性部位特異的阻害剤として作用し (K_i= 0.40 µM; IC_{50} = 0.88 µM)、UCH-L3 (製品番号 662090) より約 28 倍高い選択性を示します。UCH-L1 を発現した腫瘍細胞株 SH-SY5Y の増殖を 5 µM で促進することが明らかになっています。がん、パーキンソン病、および他の神経疾患における UCH-L1 の役割の研究に有用なツールです。透過性は細胞タイプによって異なります。						
UCH-L1 Inhibitor II	439946-22-2	314.3	≥ 85% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	662088-10MG	18,900
LDN-91946	20 µM もの高い濃度のときでも UCH-L3、TGase 2、パパインあるいはカスパーゼ 3 に対してほとんど活性を示さない一方、遊離型酵素ではない酵素基質複合体を標的にして非競合的に UCH-L1 酸触媒基質加水分解 ($K_{i\,app}$ = 2.8 µM、Ub-AMC を基質として) を阻害するチエノピリジン化合物。						
UCH-L3 Inhibitor	30675-13-9	283.9	≥ 92% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml)	662089-10MG	26,900
(4,5,6,7-Tetrachloroindan-1,3-dione; Ubiquitin C-Terminal Esterase L3 Inhibitor; Ubiquitin C-Terminal Hydrolase L3 Inhibitor; Ubiquitin Thiolesterase L3 Inhibitor)	1, 3- インダンジオン化合物。UCH-L3 に対する強力かつ選択的な阻害剤として作用し (IC_{50} = 0.6 µM)、UCH-L1 (IC_{50} = 75 µM) より約 125 倍高い選択性を示します。						
Ubiquitin E1 Inhibitor, PYR-41		425.4	≥ 90% by HPLC (sum of two isomers)	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	662105-25MG	42,900
4-(4-(5-Nitro-furan-2-ylmethylene)-3,5-dioxo-pyrazolidin-1-yl)-benzoic acid ethyl ester	E3、E2 あるいはカスパーゼ酵素活性に対してほとんど、あるいは全く活性を示さない一方、ユビキチン活性酵素 E1 活性 (IC_{50} <10 µM、無細胞 E1 ユビキチン化反応) を可逆的に (おそらく共有結合修飾を通じて) 阻害する細胞透過性ピラゾン化合物。ユビキチン化依存性タンパク質分解ならびにユビキチン化介在細胞活性を阻害します。PYR-41 や他の手段による E1 不活性化はユビキチン様タンパク質による修飾が総体的に上昇する結果になることを示しています。						
Ubiquitin Isopeptidase Inhibitor I, G5		414.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	662125-10MG	32,900
[3,5-bis((4-Nitrophenyl)methylene)-1,1-dioxide, tetrahydro-4H-thiopyran-4-one; NSC-144303]	細胞透過性の相互接合 α、β- 不飽和ジエノン化合物。ユビキチンイソペプチダーゼ活性を選択的に阻害することにより (IC_{50} =約 30 µM)、アポトソームに依存しないミトコンドリア経路を介してカスパーゼの活性化とアポトーシスを誘導します (E1A および E1A/C9DN 細胞において、それぞれ IC_{50} = 1.76 および 1.6 µM)。Bax および Bak の細胞発現は G5 活性化アポトーシスに必須ですが、Bcl-2 は G5 の効果から細胞を保護すると考えられます。G5 は Ubiquitin Isopeptidase Inhibitor II、F6 (製品番号 662126) よりも強力ですが、その他の点では同様な薬理効果を示します。						
DUB Inhibitor IV, b-AP15		419.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	662140-10MG	32,900
DUB Inhibitor V, PR-619	662141-25MG			+2℃～+8℃	DMSO	662141-25MG	28,900
USP14-Proteasome Inhibitor, IU1		300.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO	662210-10MG	24,900

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
AEBSF, Hydrochloride	30827-99-7	239.5	>97% by HPLC	room temp.	H_2O (25 mg/ml)	101500-50MG	9,000
						101500-100MG	14,000
						101500-500MG	51,000
						101500-1GM	89,000
[4-(2-Aminoethyl)benzenesulfonylfluoride, HCl]	セリンプロテアーゼの特異的かつ不可逆的な阻害剤。キモトリプシン、カリクレイン、プラスミン、トロンビン、トリプシン、および関連する血栓溶解酵素を阻害します。PMSF (製品番号 52332) および DFP (製品番号 30967) の代用となる、安定な非毒性物質です。mM 単位の濃度において、数種類の細胞株におけるアミロイドペプチド (A) 産生の阻害およびアミロイド前駆体タンパク質 (sAPPU) 分泌の促進を示す、- セクレターゼ阻害剤です。大半の用途において、PMSF と同等のモル濃度 (0.1 - 1.0 mM) で使用します。						
Leupeptin, Hemisulfate	103476-89-7	475.6	≥ 90% by HPLC	-20℃	H_2O (50 mg/ml)	108975-5MG	7,900
						108975-10MG	11,900
						108975-25MG	23,000
						108975-50MG	45,000
						108975-100MG	68,000
(Ac-LLR-CHO, 1/2H_2SO_4)	トリプシン様プロテアーゼおよびシステインプロテアーゼの可逆的阻害剤。活性化により誘導されるプログラム細胞死を阻害し、HIV^+ ドナーの欠損免疫反応を修復することも知られています。						
Leupeptin, Hemisulfate, Synthetic	103476-89-7	475.6	≥ 95% by HPLC (sum of isomers)	-20℃	H_2O (50 mg/ml)	108976-10MG	11,000
						108976-25MG	22,000
	微生物由来のトリプシン様およびシステインプロテアーゼ活性の阻害剤 Leupeptin (製品番号 108975) の同等化学合成品。						
Acetyl-Pepstatin	28575-34-0	643.8	≥ 97% by HPLC	-20℃	50% Acetic acid (5 mg/ml)	110175-1MG	44,000
[Ac-Val-Val-(3S,4S)-Sta-Ala-(3S,4S)-Sta-OH]	HIV-1 プロテイナーゼ (K_i= 20 nM at pH 4.7) および HIV-2 プロテイナーゼ (K_i= 5 nM at pH 4.7) の有効な阻害剤として作用する、アスパルチルプロテアーゼ阻害剤。基質アナログ阻害剤として作用します。						
1-PDX, Human, Recombinant, *E. coli*		47000	≥ 80% by SDS-PAGE	+4℃	H_2O (2.5 mg/ml)	126850-2.5MG	99,900
($_1$-Antitrypsin Portland)	His タグおよび FLAG タグを融合したヒト 1 アンチトリプシン遺伝子に由来する組換え体タンパク質。フリンに依存的なタンパク質前駆体のプロセッシングを効果的に阻害 (K_i= 600 pM) するフリン最小コンセンサス配列 (RXXR) を含んでいます。$_1$-PDX を細胞外に適用して、ウイルスエンベロープ糖タンパク質、細菌毒素、受容体および増殖因子などの生物学的に重要なタンパク質のプロセッシングを阻害することが可能です。*in vivo* および *in vitro* でのフリン阻害アッセイに有用。						

プロテアーゼ阻害剤

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Amastatin, *Streptomyces sp.*	67655-94-1	474.6	≥ 97% by HPLC	room temp.	DMSO (10 mg/ml)	129875-1MG	28,000
[(2S,3R)-3-Amino-2-hydroxy-5-methylhexanoyl-Val-Val-Asp-OH]	アミノペプチダーゼ A (K_i= 1 µM) およびロイシンアミノペプチダーゼ (IC_{50} = 1.6 µM) の非毒性特異的阻害剤。アミノペプチダーゼ M の競合的な slow-binding 阻害剤としても作用します。アミノペプチダーゼ B、キモトリプシン、エラスターゼ、パパイン、ペプシン、サーモリシン、トリプシンは阻害しません。						
ε-Amino-n-caproic Acid	60-32-2	131.2	>98% by titration	room temp.	H_2O (5 mg/ml)	1381-500GM	25,000
(EACA)	リジンアナログ。カルボキシペプチダーゼ B を阻害します。本品は、ストレプトキナーゼによるプラスミノーゲンの活性化を阻害することによって、プラスミンの急速な解離を促進します。						
Aminopeptidase N/CD13 Inhibitor		271.29	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	164606-10MG	24,000
4-tert-butylphenyl hydrogen 1-aminopropylphosphonate	アミノペプチダーゼ N/CD13 阻害剤 (IC_{50}=1.1 µM) として働くアルファ - アミノアラルキルホスホン酸エステル。300 µM の化合物 4d が TNF の 30 µg/ml で共処理されるとき、細胞増殖は用量依存的に PANC-1 と HT-108 細胞においてそれぞれ ~36% と ~60% 阻害されます。化合物 4d のみで処理されたとき、細胞増殖は用量依存的にそれぞれ同じ細胞株で 26% と 36% 阻害されます。						
Antithrombin III, Human Plasma	90170-80-2	58000	single band by SDS-PAGE	-20℃	H_2O. Please refer to label for lot-specific volume prior to lyophilization.	169756-1MG	56,000
(ATIII; Factor Xa inhibitor; Heparin cofactor)	トロンビンの主要な生理的阻害因子。凝固過程においてトロンビンと複合体を形成するため、血清中より血漿中に高濃度で存在します。Factor Xa、プラスミン、トロンビン、トリプシンなどの血液凝固に関与するタンパク質分解酵素に対して阻害作用を示します。ヘパリンによって作用が大幅に増強されます。単鎖糖タンパク質は正常血清中に 23 mg/100 ml 程度存在します。						
Anthrax Lethal Factor Protease Inhibitor, In-2-LF		1984.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml), 5% Acetic Acid (5 mg/ml), or H_2O (1 mg/ml)	176901-1MG	51,000
(Anthrax LF Protease Inhibitor; *Bacillus anthracis* LF Protease Inhibitor; In-2-LF)	MEK-2 テンプレートから設計した 14-mer ペプチドの細胞浸透性 N- アセチル化 C- ヒドロオキサメート誘導体。炭疽菌致死因子メタロプロテアーゼの競合阻害剤として働きます (K_i = 1 nM)。また、MEK-3 切断も阻害します。RAW264.7 細胞および J772.A1 細胞において、炭疽菌毒素が誘導する細胞毒性に対して防御します。						
α1-Antichymotrypsin, Human Plasma	141176-92-3		≥ 95% by SDS-PAGE	-20℃	Aqueous buffers. Please refer to vial label for lot-specific volume prior to lyophilization.	178196-100UG 178196-1MG	23,000 98,000
(α_1-Achy; α_1-1X-Glycoprotein; α_1-1X)	血漿中に 45 mg/100 ml の濃度で存在する急性期タンパク質。キモトリプシン様セリンプロテイナーゼの特異的阻害剤です。						
Antipain, Hydrochloride	37682-72-7	641.2		+4℃	H_2O (10 mg/ml)	178220-5MG 178220-10MG	8,000 10,000
	放線菌によって産生される、ペプチジルアルギニンアルデヒドプロテアーゼ阻害剤。Ca^{2+} 依存性エンドペプチダーゼの阻害剤です。Leupeptin (製品番号 108975) に類似した特異性を有します。トリプシン様セリンプロテアーゼ、パパイン、および一部のシステインプロテアーゼを阻害します (IC_{50}= 300 µM)。						
α2-Antiplasmin, Human Plasma		70000	≥ 95% by SDS-PAGE	-20℃	H_2O. Please refer to the vial label for the lot-specific reconstitution volume.	178221-100UG	14,900
(Primary Plasmin Inhibitor; α_2-Protease Inhibitor)	血漿中に約 70 µg/ml の濃度で存在する、452 アミノ酸残基からなる糖タンパク質。プラスミノーゲン活性化因子誘導性のフィブリンクロット溶解を強力に阻害します。プラスミンと共有結合複合体を形成し、プラスミンを不活化します。						
Antipain, Dihydrochloride	37682-72-7	677.6		+4℃	H_2O (1 mg/ml) or DMSO (5 mg/ml)	178223-10MG	21,000
	放線菌によって産生される、ペプチジルアルギニンアルデヒドプロテアーゼ阻害剤。Ca^{2+} 依存性エンドペプチダーゼの阻害剤です。Leupeptin (製品番号 108975) に類似した特異性を有します。トリプシン様セリンプロテアーゼ、パパイン、および一部のシステインプロテアーゼを阻害します (IC_{50} = 300 µM)。						
p-APMSF, Hydrochloride	74938-88-8	252.7	≥ 97% by HPLC	+4℃	H_2O (25 mg/ml)	178281-5MG	22,000
(*p*-Amidinophenylmethylsulfonylfluoride, HCl)	DFP および PMSF の代用として使用することができます。トリプシン様セリンプロテアーゼの不可逆的阻害剤です。トリプシンとトロンビンを同等のモル濃度で阻害します。C1r、C1s、Factor Xa、プラスミンに対して作用しますが、完全な不可逆的阻害を生じるためには 5-10 倍過剰な濃度が必要です。本品の阻害活性は、PMSF より約 1,000 倍強力です。						
Benzamidine, Hydrochloride	1670-14-0	156.6	≥ 97% by titration	room temp.	H_2O (>15 mg/ml)	199001-5GM 199001-25GM	7,000 16,000
	トリプシンおよびトリプシン様酵素の阻害剤。ファクター VII の自己活性化を阻害します。						
Bestatin	58970-76-6	308.4	>99% by titration (dry basis)	+4℃	DMSO (2 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml). Unstable in aqueous solution; dilute just prior to use.	200484-10MG	30,900
{[(2S,3R)-3-Amino-2-hydroxy-4-phenylbutanoyl]-Leu}	細胞表面に結合し、細胞表面アミノペプチダーゼを阻害します。特に、アミノペプチダーゼ B およびロイシンアミノペプチダーゼに対して顕著な阻害作用を示します。また、強力なアミノペプチダーゼ N 阻害剤としても作用します。マクロファージおよび T リンパ球を活性化します。本品は抗腫瘍作用を有します。						
Bestatin Methyl Ester		322.4	≥ 97% by TLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml). Unstable in aqueous solution; dilute just prior to use.	200485-5MG	33,000
{(-)-N-[(2S, 3R)-3-Amino-2-hydroxy-4-phenylbutyryl]-L-leucine Methyl Ester}	Bestatin (製品番号 200484) の細胞浸透性誘導体。ベスタチンよりわずかに強く中性アミノペプチダーゼを阻害しますが、塩基性アミノペプチダーゼに対しては、はるかに弱い活性を示します。また、Fas または TNF-α の誘導による固形腫瘍株のアポトーシスを増大させます。						
CA-074		383.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	205530-1MG	40,900
{Cathepsin B Inhibitor III; [L-3-*trans*-(Propylcarbamoyl) oxirane-2-carbonyl]-L-isoleucyl-L-proline}	エポキシサクシニルペプチド。カテプシン B に対する強力かつ不可逆的な特異的阻害剤として作用します (IC_{50} = 2.24 nM for rat liver cathepsin B)。虚血誘導性神経細胞死を抑制します。CA-074 Me (製品番号 205531) より低い細胞膜透過性を示します。						
CA-074 Me		397.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	205531-1MG	34,000
{Cathepsin B Inhibitor IV; [L-3-*trans*-(Propylcarbamoyl) oxirane-2-carbonyl]-L-isoleucyl-L-proline Methyl Ester}	CA-074 (製品番号 205530) の細胞膜透過性アナログ。細胞内カテプシン B の阻害剤として作用します。齧歯類モデルにおいて骨吸収を阻害することが報告されています。						
Cathepsin G Inhibitor I		620.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or Methanol	219372-1MG	36,900
	カテプシン G の強力かつ選択的、可逆的な競合性非ペプチド阻害剤 [IC_{50} = 53 ± 12 nM (N = 10) および K_i = 63 ± 14 nM (N = 5)]。キモトリプシンをわずかに阻害しますが (K_i = 1.5 ± 0.2 µM)、トロンビン、Factor Xa、Factor IXa、プラスミン、トリプシン、トリプターゼ、プロテイナーゼ 3 およびヒト白血球エラスターゼはほとんど阻害しません (100 µM において< 50%)。						

プロテアーゼ阻害剤

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Cathepsin K Inhibitor I		582.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	Methanol (1 mg/ml) or DMSO	219377-5MG	36,900
[1,3-Bis(N-carbobenzoyloxy-L-leucyl)amino Acetone; 1,3-Bis(CBZ-Leu-NH)-2-propanone]	カテプシン K の強力かつ選択的な可逆的阻害剤として働く、細胞浸透性の合成ビス（アシルアミノ）ケトン化合物（$K_{i,app}$ = 22 nM）。						
Cathepsin K Inhibitor II		697.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml)	219379-1MG	26,900
[1-(N-Benzyloxycarbonyl-leucyl)-5-(N-Boc-phenylalanyl-leucyl)carbohydrazide; Inhibitor Boc-I; Z-L-NHNHCONHNH-LF-Boc]	カテプシン K の強力かつ選択的な可逆的阻害剤として働く細胞浸透性ペプチジル・ビス - カルボヒドラジド化合物（$K_{i,app}$ = 6.0 nM）。						
Cathepsin K Inhibitor III		597.7	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml)	219381-1MG	41,000
[1-(N-Benzyloxycarbonyl-leucyl)-5-(phenylalanyl-leucyl)carbohydrazide; Inhibitor I; Z-L-NHNHCONHNH-LF-NH_2]	カテプシン K の強力かつ選択的な可逆的阻害剤として働く細胞浸透性ペプチジル・ビス - カルボヒドラジド化合物（$K_{i,app}$ = 9.7 nM）。						
Cathepsin B Inhibitor II		384.5	≥ 95% by HPLC	-70℃	H_2O (1 mg/ml)	219385-1MG	22,900
(Ac-LVK-CHO)	Leupeptin（製品番号 108975）のリシナールアナログ。ロイペプチン（IC_{50} = 310 nM）より強力なカテプシン B 阻害剤です（IC_{50} = 4 nM）。						
Cathepsin S Inhibitor		424.5	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	219393-1MG	24,900
(Z-FL-COCHO)	リコンビナント cathepsin S の結合速度の遅い・強結合性、可逆的阻害剤（K_i= 185 pM）。cathepsin B（K_i= 76 nM）に比べ 410 倍の選択性を cathepsin S に対して示します。						
Cathepsin Inhibitor I		475.5	> 90% by HPLC	room temp.	Acetonitrile, DMSO, or Ethanol	219415-1MG	28,900
(Z-FG-NHO-Bz)	システインプロテアーゼ阻害剤。カテプシン B（k_2/K_i= 8.9 x 10^3 M^{-1} sec^{-1}）、カテプシン L（k_2/K_i= 3.8 x 10^5 M^{-1} sec^{-1}）、カテプシン S（k_2/K_i= 4.2 x 10^4 M^{-1} sec^{-1}）、およびパパイン（k_2/K_i= 2.4 x 10^3 M^{-1} sec^{-1}）を選択的に阻害します。						
Cathepsin Inhibitor III		505.5	> 90% by HPLC	room temp.	DMSO (5 mg/ml) or Ethanol (1 mg/ml)	219419-1MG	28,900
(Z-FG-NHO-BzOME)	システインプロテアーゼ阻害剤。カテプシン B（k_2/K_i= 1.0 x 10^4 M^{-1} sec^{-1}）、カテプシン L（k_2/K_i= 1.5 x 10^5 M^{-1} sec^{-1}）、カテプシン S（k_2/K_i= 6.6 x 10^4 M^{-1} sec^{-1}）、およびパパイン（k_2/K_i= 1.0 x 10^3 M^{-1} sec^{-1}）を選択的に阻害します。						
Cathepsin/Subtilisin Inhibitor		518	> 90% by HPLC	room temp.	Acetonitrile, DMSO, or Ethanol	219420-1MG	28,000
(Boc-VF-NHO-Bz-*p*Cl)	カテプシン L などのシステインプロテアーゼファミリーに属する酵素、ならびに subtilisin Carlsberg や thermitase などのセリンプロテアーゼファミリーに属する酵素を阻害します。						
Cathepsin L Inhibitor I		462.5	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (20 mM)	219421-1MG	23,900
(Z-FF-FMK)	Cathepsin L（製品番号 219402）に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤です。						
Cathepsin L Inhibitor II		446.5	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO or Ethanol (50 mg/ml)	219426-5MG	18,900
(Z-FY-CHO)	強力かつ選択的なカテプシン L 阻害剤です。						
Cathepsin L Inhibitor III		542.6	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	219427-5MG	28,900
[Z-FY(*t*-Bu)-DMK]	カテプシン L の不可逆的阻害剤。カテプシン S よりカテプシン L に対して約 10^4 倍強力な作用を示します。						
Cathepsin L Inhibitor IV		491.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	219433-1MG	19,900
(1-Naphthalenesulfonyl-IW-CHO)	強力なカテプシン L 阻害剤（IC_{50} = 1.9 nM）。また、*in vitro* 骨培養系において骨からの Ca^{2+} およびヒドロキシプロリンの放出を阻害し、卵巣摘出マウスにおいて骨損失を抑制します（約 50 mg/kg）。						
Cathepsin L Inhibitor, CAA0225		487.55	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	219502-1MG	26,900
	ラット肝臓カテプシン L（IC_{50} = 1.9 nM）用の非常に選択的な Epoxysuccinyl ペプチドで、*in vitro* で 1000-5000 nM より高い濃度のときラット肝臓カテプシン B においてほとんど、あるいはまったく効果を示しません。オートファジーの間、CAA0225（10 µg/ml）が栄養不足の HeLa と Huh-7 細胞において、コントロールと比較して LC3-II ならびに GABARAP の分解を効果的に阻害することが免疫ブロット法によって見られることが示されています。						
Chymostatin	9076-44-2			+4℃	DMSO (20 mg/ml), 5% glacial acetic acid (10 mg/ml)	230790-5MG 230790-10MG 230790-25MG	11,000 19,000 41,900
{[(S)-1-Carboxy-2-phenylethyl]-carbamoyl-α-[2-amidohexahydro-4(S)-pyrimidyl]-(S)-glycyl-[A = Leu; B = Val; or C = Ile]-phenylalaninal}	主成分は A 型です。放線菌によって産生されるプロテアーゼ阻害剤です。キモトリプシン、パパイン、および大半のシステインプロテアーゼを特異的に阻害します。						
Cystatin C, Human Urine		13000	≥ 95% by SDS-PAGE	+4℃	0.1 M sodium acetate buffer, pH 4.5	240896-50UG	22,900
(Post γ-globulin)	システインプロテアーゼ阻害剤であるシスタチンスーパーファミリーに属する、低分子量の非グリコシル化塩基性タンパク質です。糸球体膜によって容易に濾過されます。シスタチン C の血清中濃度は、糸球体濾過率の特異的かつ感度の高いマーカーとして利用することができます。本品は、内因性または外因性の酵素による望ましくないタンパク質分解から生体を保護します。アルツハイマー病、遺伝性脳出血、肺がんなどの様々な疾患プロセスに関連していると考えられています。						
1,5-Dansyl-Glu-Gly-Arg Chloromethyl Ketone, Dihydrochloride	251700-5MG	699.1		+4℃	Reconstitute at 1 mg/ml in 10 mM HCl. Dilute with physiological buffers just prior to use.	251700-5MG	48,900
(1,5-DNS-GGACK,2HCl)	プラスミノーゲン活性化因子、Factor Xa、およびウロキナーゼに対する強力な不可逆的阻害剤です。蛍光団によって標識酵素の相互作用を直接測定することができます。						

その他

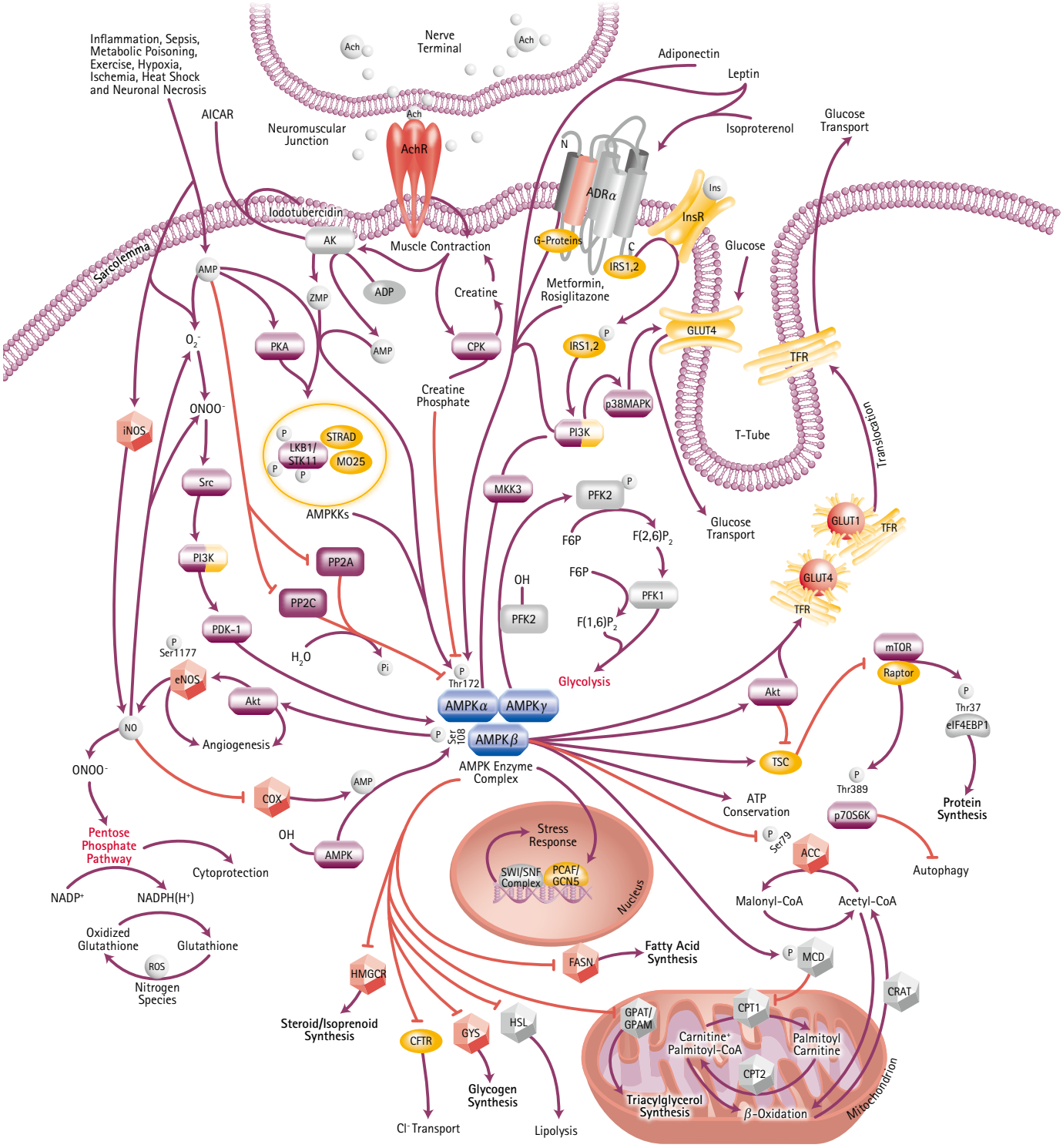
	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Dipeptidylpeptidase IV Inhibitor III	866396-34-1	312.8	≥ 97% by HPLC	+4℃	Ethanol (20 mg/ml), H_2O (20 mg/ml), or PBS (20 mg/ml)	317641-5MG	31,900
	細胞透過性のジシアノピロリジン化合物。DPP IV に対する遅延結合性、可逆的、活性部位ターゲティング阻害剤として作用し（hrDPP IV, ラット、イヌ、サルおよびヒトの血漿 DPP IV に対する IC_{50} = 104 nM、38 nM、109 nM、92 nM および 69 nM）、DPP II、DPP III、DPP VIII、DPP IX、FAP および APP（IC_{50}> 30 µM）に対するより高い選択性を示します。経口投与可能で、いくつかの動物モデルにおいてグルコースレベルを大幅に低下させグルカゴン様ペプチド -1 レベルを大幅に上昇させることが知られています。						
Dipeptidylpeptidase IV Inhibitor IV, K579	440100-64-1	328.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (32 mg/ml), Ethanol (6.5 mg/ml), or 1 eq HCl (16 mg/ml) Please note: 328.4 is the anhydrous molecular weight; please refer to the vial label for the lot-specific hydration and molecular weight.	317642-5MG	38,000
	細胞透過性のシアノピロリジン化合物。DPP IV の強力な可逆的、遅延結合性、活性部位ターゲティング阻害剤として作用します（ラット、イヌ、サル、ヒトにおける IC_{50} = 3 nM、8 nM、8 nM、5 nM）。グルコースレベルを抑制し、血漿中で速やかに代謝を受けるが持続性の作用を発揮することが知られています。また、GLP-1（グルカゴン様ペプチド -1）レベルを大幅に上昇させ、いくつかのげっ歯類モデルでグルコース負荷に対するインスリン分泌を刺激します。						
Elastatinal	51798-45-9	512.6		+4℃	H_2O (5 mg/ml)	324691-5MG	24,000
	放線菌によって産生される、エラスターゼ様セリンプロテアーゼの阻害剤です。PMSF 刺激によるヒストン H1 タンパク質および HMG タンパク質の分解を阻害します。また、α_2- マクログロブリンプロテアーゼ複合体に対しても阻害作用を示します。						
E-64 Protease Inhibitor	66701-25-5	357.4	Single spot by TLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml) or H_2O (20 mg/ml)	324890-1MG 324890-5MG 324890-25MG	10,900 36,000 124,000
	システインプロテアーゼの不可逆的阻害剤。プロテアーゼの S_0 サブサイトと相互作用します。本品は、他のタンパク質のシステイン残基に対しては活性を示しません。活性化誘導性プログラム細胞死を抑制し、HIV^+ ドナーにおける免疫応答不全を回復させます。特異的な active site titrant です。						
Ecotin, *E. coli*		32200	≥ 90% by SDS-PAGE	-70℃		330200-100UG	37,000
	セリンプロテアーゼの強力かつ広範な阻害剤。キモトリプシン、エラスターゼ、Factor Xa、Factor XIIa、カリクレインおよびトリプシンの阻害に関して、ピコモルレベルの結合定数を示します。また、コラゲナーゼの効果的な阻害剤でもあります。						
EDTA, Tetrasodium Salt	13235-36-4	452.2	≥ 99% by titration	room temp.	H_2O (200 mg/ml)	34103-500GM	14,000
(Ethylenediaminetetraacetic Acid, 4Na)	イオン交換、金属キレート化、抗酸化手順、分光光度滴定やその他の化学法に使う有機キレート剤。						
FUT-175	82956-11-4	539.6	≥ 98% by HPLC	+4℃	H_2O (5 mg/ml). The use of PBS or other phosphate-containing buffers should be avoided as it may reduce solubility.	344960-5MG	40,900
(6-Amidino-2-naphthyl-4-guanidinobenzoate Dimethanesulfonate; Futhan; Nafamostat Mesylate)	化学合成した広い特異性を持つセリンプロテアーゼ阻害剤。凝固系、補体系、グランザイム A を強力に阻害します。また Hageman factor および Factor Xa をマイクロモル弱濃度で阻害します。						
GGACK		392.8	≥ 80% by HPLC	-20℃	H_2O (50 mg/ml)	347436-5MG	39,900
(Glu-Gly-Arg-chloromethyl Ketone)	ウロキナーゼ（IC_{50} < 1 µM）および Factor Xa の不可逆的阻害剤。						
2-Guanidinoethylmercaptosuccinic Acid	77482-44-1	235.2	≥ 99% by TLC	+4℃	H_2O	369334-5MG	40,000
(GEMSA)	エンケファリンコンバターゼと呼ばれるカルボキシペプチダーゼ B 様プロセシング酵素の強力な阻害剤（K_i= 8.8 nM）。エンケファリンコンバターゼのアフィニティクロマトグラフィへの使用に最適です。						
Hirudin, Hirudo medicinalis, Recombinant, *Saccharomyces cerevisiae*	8001-27-2	6970.4		+4℃	H_2O. Reconstitute with 1 ml H_2O.	377853-2000U	91,900
	Tyr^{63} の硫酸残基欠失型 HV1。高度に特異的な抗トロンビン特性を示します。トロンビンの基質結合部位を遮断して不活性化します。						
α-Iodoacetamide	144-48-9	185	≥ 99% by Titration	-20℃	H_2O, DMF, Ethanol, or Methanol (1:20)	407710-25GM	24,000
	数種類のシステインプロテアーゼの不可逆的阻害剤。システインおよびメチオニン残基のアルキル化に有用です。						
Iodoacetic Acid, Sodium Salt	305-53-3	207.9	≥ 98% by titration	-20℃	H_2O (100 mg/ml)	407719-25GM	15,900
	システインプロテアーゼを阻害します。						
Dipeptidylpeptidase IV Inhibitor I		341.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	416200-5MG	27,900
(Diprotin A)	ジペプチジルペプチダーゼ IV（DPP IV）の阻害剤です。						
(Z-LL)2 Ketone		809	single spot by TLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml)	421050-5MG	21,900
[1,3-di-(N-Carboxybenzoyl-L-leucyl-L-leucyl) amino Acetone]	新規システインプロテアーゼ阻害剤で、特異的に効率良く p-Prl シグナルペプチド切断を阻害（IC_{50} 約 50 nM）します。シグナルペプチダーゼや他のリソソームカテプシンやプロテアソームプロテアーゼには影響しません。						
Kininogen, High Molecular Weight, Single Chain, Human Plasma		120000	≥ 95% by SDS-PAGE	-70℃		422686-1MG	75,000
	接触活性化系における非酵素的補因子です。プレカリクレインを負に荷電した表面に結合させ、表面結合 α-XIIa 因子により活性化してカリクレインとします。また XI 因子と複合体を形成して血漿中を循環し、αXIIa 因子による XI 因子から XIa 因子への活性化において作用します。低血圧の研究において重要な血管活性ペプチドであるブラジキニンはこの物質から生成します。						
α2-Macroglobulin, Human Plasma		725000	≥ 95% by SDS-PAGE	-20℃	Aqueous buffers	441251-1MG 441251-10MG	20,000 122,000
(α_2M; α_2MG)	非可逆性広スペクトルプロテアーゼ阻害剤として作用する多機能性分泌糖タンパク質。大半のプロテアーゼの周囲に「トラップ」を形成します。α_2M は非常に大きな分子であるので、血管内に留まる傾向にあります。抹消血リンパ球の表面に局在しています。多機能活性には、培養哺乳類細胞の成長促進、放射線照射マウスのリンパ球再生の促進、亜鉛の輸送、凝血および線維溶解系を調節するプロテイナーゼ阻害剤としての作用が含まれます。						

プロテアーゼ阻害剤

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Marimastat	154039-60-8	331.4	≥ 98% by NMR	+4℃	DMSO (15 mg/ml)	444289-5MG	43,900
BB-2516	経口投与可能なペプチドヒドロキサメート化合物。MMP/TACE の強力かつ可逆的な基質競合的阻害剤かつ活性部位 Zn^{2+} 結合阻害剤という二重の選択性をもつ阻害剤です（MMP-1、-2、-3、-7、-8、-14 および TACE に対する IC_{50} はそれぞれ 5、6、200、20、2、1.8 および 3.8 nM）。腫瘍細胞の浸潤を軽減し、腫瘍の増殖を阻害し転移を防止すると報告されています。また、促進されていた TNF-α および CD30 の産生を低下させます（ヒト全血および Karpas299 細胞における IC_{50} はそれぞれ 7.0 μM および 1.0 μM）。						
DL-2-Mercaptomethyl-3-guanidinoethylthiopropanoic Acid		237.3	≥ 95% by TLC	+4℃	Degassed H_2O. Addition of a small amount of NaOH or NH^4OH may be necessary to achieve complete solubilization.	445825-100MG	24,900
(Plummer's Inhibitor)	ヒト血漿カルボキシペプチダーゼ N の強力な可逆性阻害剤（K_i=2 nM）。ブラジキニンの加水分解を阻害します。						
Pepstatin A, Synthetic	26305-03-3	685.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (1 mg/ml) or Methanol (1 mg/ml)	516481-5MG 516481-25MG 516481-100MG	11,900 31,900 89,000
(Isovaleryl-Val-Val-4-amino-3-hydroxy-6-methylheptanoyl-Ala-4-amino-3-hydroxy-6-methylheptanoic Acid; Iva-Val-Val-Sta-Ala-Sta)	アスパラギン酸プロテアーゼの可逆的阻害物質。カテプシン D、ペプシンおよびレニンを阻害します。PC12 細胞株において CA-074（製品番号 205530）に誘導されるアポトーシスを阻害することが報告されています。 有効作業濃度　1.0 μM						
Pepstatin A, Penetratin		2914.6	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	516483-1MG	44,000
PepA-RQIKIWFQNRRMKWKK-OH	MCF7 乳癌細胞のアスパラギン酸プロテアーゼを阻害する Pepstatin A（製品番号 516481）の細胞膜透過性類縁体。Pepstatin A よりも 10 倍以上強力です。さらに、抗原処理成分へのアクセス能に優れ、PBMC、一次樹状細胞、一次 B 細胞において破傷風トキソイドの処理および透過を効果的に減少させます。*in vitro* 測定においてペプスタチン A と比較した場合、力価は約 1/4 です（カテプシン E およびカテプシン D に対して、ペプスタチン A の IC_{50} はそれぞれ 0.255 μmol/L および 0.21 μmol/L であり、ペプスタチン A-P の IC_{50} はそれぞれ 0.92 μmol/L および 0.92 μmol/L です）。						
o-Phenanthroline	5144-89-8	198.2	≥ 99% by titration	room tem	DMSO (100 mg/ml), ethanol (25 mg/ml), or H_2O (3 mg/ml)	516705-500MG	15,900
(1,10-Phenanthroline Monohydrate)	ストレプトゾトシン処理した細胞の染色体異常を防止する金属キレート剤。金属プロテアーゼ阻害物質として作用します。						
PPACK II, Trifluoroacetate Salt	74392-49-7	729.1	≥ 90% by HPLC	+4℃	H_2O (100 mg/ml)	520219-10MG	45,000
	血漿および腺性カリクレインの強力かつ特異的な不可逆的阻害物質。						
PPACK, Dihydrochloride	142036-63-3	523.9	≥ 80% by HPLC	+4℃	5% Acetic Acid (5 mg/ml) or 10 mM HCl (1 mg/ml)	520222-5MG 520222-25MG	39,900 98,000
	トロンビンの極めて強力かつ選択的な不可逆的阻害物質。組織プラスミノーゲンアクチベーターである VIIa 因子および XIa 因子の阻害にも使用できます。						
PPACK, Dihydrochloride, Biotinylated		979.5	≥ 80% by HPLC	-20℃		520224-1MG	98,000
(Biotin-X-D-Phe-Pro-Arg-chloromethylketone, 2HCl)	製品番号 520222 をビオチン - X 修飾したもの。活性セリンプロテアーゼの特異的プローブ。トロンビンおよび組織プラスミノーゲンアクチベーター（tPA）の強力な阻害物質。VIIa 因子、XIa 因子、トロンビンおよび tPA のウエスタンブロット試験に有用です。						
Phenylmethylsulfonyl Fluoride	329-98-6	174.2	≥ 99% by GC	room temp.	Ethanol, isopropanol, or methanol	52332-1GM 52332-5GM 52332-25GM	3,900 8,900 25,000
(Benzylsulfonyl Fluoride; PMSF)	セリンプロテアーゼの不可逆的阻害物質。その作用機序はジイソプロピルフルオロリン酸に類似しています。PMSF は活性部位にあるセリン残基のスルフォニル化を引き起こします。また未熟胸腺細胞のヌクレオソーム間 DNA 断片化の阻害も報告されています。本品と関連する安定性の高い阻害物質としては AEBSF（製品番号 101500）があります。						

AMPK Enzyme Complex Pathway



プロテアーゼ阻害剤

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Phosphoramidon, Disodium Salt		587.5	Single spot by TLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）, methanol, or H_2O	525276-5MG	40,900
[N-(α-Rhamnopyranosyloxyhydroxyphosphinyl)-L-leucyl-L-tryptophan, 2Na]	一部の金属エンドペプチダーゼを阻害します。特異性の高いサーモリシン阻害物質です。高分子量エンドセリン -1 からエンドセリンへの変換を阻害します（IC_{50}= 4.6 µM）。						
Prolyl Endopeptidase Inhibitor II		330.4	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）, DMF, ethyl acetate	537011-5MG	36,900
(Z-PP-CHO)	細胞透過性のジペプチドアルデヒド。プロリルエンドペプチダーゼに対して特異的、強力、緩徐かつ緊密に結合する遷移状態アナログ阻害剤として作用します [K_i= 350 pM（マウス脳）、500 pM（ヒト脳）]。酵素の活性部位セリンとヘミアセタールを形成することが報告されています。						
Proteinase K Inhibitor		551	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（3 mg/ml）	539470-10MG	42,000
MeOSuc-AAPF-CMK	テトラペプチジルクロロメチルケトン化合物。プロテイナーゼ K（カタログ番号 539480、カタログ番号 70663、カタログ番号 71049）の強力な活性部位直接作用かつ可逆的阻害剤として作用し、従来の MeOSuc-AAPV-CMK 阻害剤の 10 倍の阻害効率を示します。						
Aprotinin, Bovine Lung, Crystalline	9087-70-1	6512	≥ 95% by gel filtration	+4℃	H_2O（10 mg/ml）	616370-10MG 616370-20MG 616370-100MG	11,900 22,900 84,900
Pancreatic Trypsin Inhibitor	58 アミノ酸からなる一本鎖ポリペプチド。エステラーゼ活性・プロテアーゼ活性の競合的かつ可逆的な阻害剤。強固な複合体を形成し、酵素の活性部位を遮断します。キモトリプシン、血餅形成の prephase に関与する凝固因子、カリクレイン（K_d = 1 x 10^{-7}M）、プラスミン（K_d = 2.3 x 10^{-10} M）、組織・白血球のプロテイナーゼ、トリプシン（K_d = 5 x 10^{-14}M）などの様々なプロテアーゼを阻害します。Factor Xa およびトロンビンの阻害作用は示しません。酸および熱に対して比較的安定です。チモーゲン活性化系の研究におけるタンパク質精製中のセリンプロテアーゼ阻害剤として有用です。組織培養において、細胞の寿命を延長させ、無傷細胞に対するタンパク質分解性損傷を防止します。標的プロテアーゼと等モルで効率的に阻害します。至適 pH5 - 7、pI10.5						
Aprotinin, Bovine, Recombinant, *Nicotiana sp.*, Animal-Free	9087-70-1	6512	≥ 95% by SDS-PAGE	+4℃		616371-1MG 616371-5MG 616371-25MG	15,000 21,000 41,900
(Antikrein; Basic Pancreatic Trypsin Inhibitor; Kallikrein-Trypsin Inactivator; Pancreatic Trypsin Inhibitor; Trypsin-Kallikrein Inhibitor)	アプロチニンはセリンプロテイナーゼの可逆的な多価阻害剤です。本品はトリプシン、キモトリプシン、カリクレインおよびプラスミンなど、さまざまなプロテアーゼを阻害します。動物由来の成分は含みません。						
Nα-Tosyl-Lys Chloromethyl Ketone, Hydrochloride	4238-41-9	369.3	≥95% by elemental analysis	+4℃	Aqueous solutions pH < 6.0（1 mg/ml）	616382-50MG 616382-250MG	11,900 34,900
(TLCK)	トリプシン様セリン・プロテイナーゼを阻害します。キモトリプシンに影響することなく、不可逆的にトリプシンを不活化します。また、iNOS 遺伝子の転写を妨げることにより、活性化マクロファージによる一酸化窒素の生成を防ぎます。細胞 - 細胞接着および HIV-1 ウイルスの標的赤血球への結合をブロックするほか、マクロファージにおいてインターフェロン -γ と LPS によって誘導される一酸化窒素合成酵素をブロックします（EC_{50}= 80 µM）。HL-60 白血病細胞および正常胸腺細胞のアポトーシスに伴うヌクレオチド鎖切断を妨げます。						
Aprotinin, Bovine Lung, Solution	9087-70-1	6512		+4℃		616399-100KU 616399-500KU	15,900 44,900
(Kallikrein Inactivator)	タンパク質分解活性とエステル分解活性の競合的可逆的阻害剤。比較的に熱安定的、酸安定的なセリン・プロテアーゼ阻害剤。酵素の活性部位をブロッキングして堅固な複合体を形成します。プロテアーゼの等モル濃度で効果を発揮します。血液凝固、組織プロテイナーゼや白血球のプロテイナーゼ、キモトリプシン、トリプシン（K_d = 5 x 10-14 M）、プラスミン（K_d = 2.3 x 10-10 M）そしてカリクレイン（K_d = 1 x 10-7 M）における凝固因子を含む複数のプロテアーゼを阻害します。アプロチニンに阻害をされないプロテアーゼは、xa 因子、トロンビン、ペプシン、パパインそしてカルボキシペプチダーゼ A ならびに B です。タンパク質の精製やタンパク質分解の損傷を防ぐことで培養の細胞の寿命を延ばすのに役立ちます。Note: 1 KU = 1000 K.I.U.						
D-Val-Phe-Lys Chloromethyl Ketone, Dihydrochloride		497.9	> 90% by TLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	627624-5MG	37,900
(Plasmin Inhibitor, 2HCl)	プラスミンの選択的かつ非可逆的な阻害剤。ウロキナーゼに比べ、プラスミンに対して高い選択性を示します。						
Trypsin Inhibitor, Corn	9035-81-8	14000	Single band by SDS-PAGE	-70℃	Aqueous buffers	650345-1MG	54,000
	トリプシンの特異的な阻害剤。また、ヒト第 XIIa 凝固因子も阻害します。作物の真菌病原体に対する宿主抵抗性に働いていると考えられます。						
Trypsin Inhibitor, Soybean	9035-81-8	20000		-20℃	67 mM potassium phosphate, pH 7.6（5 mg/ml）	65035-100MG 65035-1GM	16,000 71,000
	化学量論的、pH 依存的な方法でトリプシンに結合するトリプシンの可逆的阻害剤（K_d = 500 nM at pH 7.8）。						
Trypsin Inhibitor, Soybean, High Activity	9035-81-8	20000	≥ 90% by SDS-PAGE	-20℃	67 mM potassium phosphate buffer, pH 7.6（5 mg/ml）	650357-100MG 650357-250MG	13,900 26,900
	Rackis の第 VI 成分。						

Akt（Protein Kinase B）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Akt Inhibitor		578.8	≥ 95% by TLC	−20℃	DMSO（200 mg/ml）. Use anhydrous DMSO for reconstitution.	124005-1MG	23,000
[1L6-Hydroxymethyl-chiro-inositol-2-（R）-2-O-methyl-3-O-octadecyl-*sn*-glycerocarbonate]	フォスファチジルイノシトールエーテルのアナログ。Akt（PKB）を強力かつ選択的に阻害します（IC_{50} = 5.0 ± 1.7 μM）。フォスファチジルイノシトール 3- キナーゼ（PI 3-K）に対しては弱い作用を示すに過ぎません（IC_{50} = 83.0 ± 21 μM）。また、1 - 10 μM の濃度範囲において、様々ながん細胞株の増殖を阻害します。						
Akt Inhibitor II		598.7	≥ 98% by NMR	−20℃	DMSO（10 mg/ml）	124008-1MG	63,900
（SH-5）	PDK-1 または下流に位置する他のキナーゼのリン酸化に影響することなく、Akt および特定の下流の基質の活性化を阻害する新たな Akt 阻害剤。さまざまながん細胞株に対してアポトーシスの強力なインデューサーとして作用します。						
Akt Inhibitor III		568.7	≥ 98% by NMR	−20℃	DMSO（10 mg/ml）	124009-1MG	65,000
（SH-6）	PDK-1 または下流に位置する他のキナーゼのリン酸化に影響することなく、Akt および特定の下流の基質の活性化を阻害する新たな Akt 阻害剤。アポトーシスの強力なインデューサーとして作用します。						
Akt Inhibitor IV	681281-88-9	614.6	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	124011-1MG 124011-5MG	26,900 89,000
	Akt の上流であるが PI3K の下流に位置するキナーゼの ATP 結合部位を標的化することにより、Akt のリン酸化 / 活性化を阻害する細胞透過性のベンゾイミダゾール化合物。786-0 細胞において Akt が媒介する FOXO1a の核外移行（IC_{50} = 0.625 μM）と細胞増殖（IC_{50} < 1.25 μM）を妨げることが示されています。フォスファチジルイノシトール類似体ベースの Akt 阻害剤（製品番号 124005、124008、124009）とは異なり、この阻害剤は PI3K には影響しません。						
Akt Inhibitor V, Triciribine	35943-35-2	320.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）. Further dilute at aqueous buffer in low micromolar concentrations.	124012-1MG	39,900
（Akt/PKB Signaling Inhibitor-2; API-2; NSC 154020; TCN）	PI3K または PDK 以外の Akt エフェクター分子を標的化することによって、選択的に Akt1/2/3 の細胞リン酸化 / 活性化を阻害する細胞透過性の三環状ヌクレオシド。PKC、PKA、SGK、Stat3、p38、ERK1/2 または JNK が媒介する細胞シグナル経路に対しては、ほとんど影響を示しません。異常な Akt 活性をもつがん細胞において優先的にアポトーシスと増殖阻止を誘導することが *in vitro*（20 μM で 60% 以上の細胞増殖）と *in vivo*（腹腔内投与 1 mg/kg/ 日でマウスの腫瘍成長に 80% 以上の阻害）の両方で示されています。						
Akt Inhibitor VI, Akt-in		1871.1	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O（1 mg/ml）	124013-2MG	39,900
（H-AVTDHPDRLWAWEKF-OH; $TCL1_{10-24}$）	プロトオンコジーン $TCL1_{10-24}$ の 15mer ペプチド。Akt の特異的阻害剤として作用する、Akt のコアクチベーターです。Akt-PH ドメインに結合して（K_d 約 18 μM）Akt- フォスフォイノシチド相互作用を阻害し、それによって細胞質からの膜透過ならびに以降の生体反応を抑制することが明らかになっています。						
Akt Inhibitor VII, TAT-Akt-in		3412.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O（1 mg/ml）	124014-2MG	70,900
（H-YGRKKRRQRRR-AVTDHPDRLWAWEKF-OH; TAT-$TCL1_{10-24}$）	Akt Inhibitor VI、*Akt-in*（製品番号 124013）に抗腫瘍作用を示すタンパク質導入ドメイン TAT を融合させた、細胞透過性の Akt 阻害剤です。PDGF で刺激した HEK 293 細胞および QRsP-11 線維肉腫細胞において、Akt のリン酸化を選択的に抑制します（約 50 μM で完全抑制）。PKA、PKC、PDK1、p42/44 MAPK、および p38 MAPK にはほとんど阻害作用を示しません。T4 細胞の増殖を抑制し、アポトーシスの誘導によって同系 C57BL/6 マウスの腫瘍増殖を抑制する（2 μM/mouse）ことが明らかになっています。						
InSolution™ Akt Inhibitor IV		614.6	≥ 98% by HPLC	+4℃		124015-1MG	26,000
	DMSO に Akt 阻害剤（製品番号 124011）の入った 10 mM（1 mg/163 μl）の溶液。						
InSolution™ Akt Inhibitor VIII, Isozyme-Selective, Akti-1/2		551.6	≥ 95% by HPLC	−70℃		124017-1MG	39,900
	Akt Inhibitor VIII、Isozyme-Selective、Akti-1/2（製品番号 124018）の 10 mM（1 mg/181 μl）DMSO 溶液です。						
Akt Inhibitor VIII, Isozyme-Selective, Akti-1/2	612847-09-3	551.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	124018-1MG 124018-5MG	34,900 70,000
[Akti-1/2; 1,3-Dihydro-1-（1-（（4-（6-phenyl-1H-imidazo[4,5-g]quinoxalin-7-yl）phenyl）methyl）-4-piperidinyl）-2H-benzimidazol-2-one]	細胞膜透過性のキノキサリン化合物。Akt1/Akt2 キナーゼの強力で選択的な阻害剤 （*in vitro* キナーゼアッセイにより Akt1、Akt2、Akt3 に対してそれぞれ IC_{50} = 58 nM、210 nM、2.12 μM）。阻害は pleckstrin homology（PH）領域依存性と考えられます。PH 領域を欠損した Akt や、PKA、PKC、SGK などに対しては 50 μM でも効果を示しません。腫瘍細胞における、Akt 系の化学療法耐性を克服します。培養細胞、マウス *in vivo* において Akt1/Akt2 のリン酸化、活性化をブロックします。						
Akt Inhibitor IX, API-59CJ-OMe	98510-80-6	404.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O（5 mg/ml）	124019-5MG	48,000
（9-Methoxy-2-methylellipticinium acetate; MMEA; NSC 627505）	細胞膜透過性のエリプチシン化合物。cAkt 活性が上昇した子宮体がん細胞（RL95-2 and Ishikawa）において強力かつ選択的にアポトーシスを誘導します（有効濃度 12-24 μM）。Akt 活性の低い細胞には効果を示しません。Akt のキナーゼ活性に直接作用しますが、Akt、ERK1/2、JNK1/2、PDK1、PKC アイソフォーム、SGK をリン酸化する反応は阻害しません。						
Akt Inhibitor X	925681-41-0	381.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O（1 mg/ml）	124020-5MG	55,000
[10-（4'-（N-diethylamino）butyl）-2-chlorophenoxazine, HCl]	細胞透過性のフェノキサジン化合物。Akt のリン酸化およびその *in vitro* キナーゼ活性を選択的に阻害し（< 5 μM で完全阻害）、PI 3-K、PDK1 および SGK1 にはほとんど影響を与えません。Rh（横紋筋肉腫）細胞株の増殖を抑制し（IC_{50} = 2-5 μM）、IGF-1 刺激による Akt の核移行を阻害し、下流標的（mTOR、p70S6 キナーゼおよび S6 リボソームタンパク質）のリン酸化を阻害します。Akti1/2（製品番号 124018）とは異なり、阻害の機序は PH ドメインに依存していません。						
Akt Inhibitor XI		381.7	≥ 98% by Elemental Analysis	+4℃	H_2O（5 mg/ml）or DMSO（2 mg/ml）	124028-5MG	52,900
[3-Formylchromone thiosemicarbazone, Cu（II）Cl_2 Complex; FPA-124]	細胞透過性の銅複合体（Cu^{2+}/Cu^{+} 酸化還元対は +0.28 - +0.35 V の範囲）。Akt の PH ドメインとキナーゼドメインの両方と相互作用し、そのキナーゼ活性を強力に阻害します（IC_{50} = 100 nM）。*in vitro* の培養細胞（IC_{50} は 10 - 34 μM の範囲）と *in vivo* のマウス（25 mg/kg の静注）の両方で腫瘍の増殖を阻害し、動物に明白な有害効果を与えません。						
Akt Inhibitor XII, Isozyme-Selective, Akti-2		747.2	≥ 97% by HPLC (mixture of regioisomers)	+4℃	DMSO（25 mg/ml）or H_2O（50 mg/ml）	124029-2MG	55,000
	細胞透過性かつ水溶性の Akt Inhibitor VIII、Isozyme-Selective、Akti-1/2（製品番号 124018）のアナログ。プレクストリン相同（PH）ドメイン依存的、非 ATP 競合的、アロステリックな中程度の Akt2 阻害剤として作用します（Akt2、Akt1、Akt3 に対する IC_{50} = 0.805 μM、> 10 μM、> 10 μM）。PKA、PKC および SGK（IC_{50} > 50 μM）に対するより約 60 倍高い選択性を示します。						
Akt Inhibitor XIII, Isozyme-Selective, Akti2-1/2		763.2	≥ 97% by HPLC (mixture of regioisomers)	+4℃	DMSO（25 mg/ml）or H_2O（50 mg/ml）	124030-2MG	55,000
	Akt Inhibitor VIII、Isozyme-Selective、Akti-1/2（製品番号 124018）のアナログ。細胞透過性かつ水溶性です。Akt1/2 のプレクストリン相同（PH）ドメイン依存的、非 ATP 競合的、アロステリック阻害剤として作用し（*in vitro* キナーゼアッセイにおける Akt1、Akt2、Akt3 に対する IC_{50} = 560 nM、390 nM、7.8 μM；LNCaP 細胞における Akt1、Akt2、Akt3 に対する IC_{50} = 526 nM、730 nM、> 10 μM）、PKA、PKC、SGK（IC_{50} > 50 μM）に対するより約 80 倍高い選択性を示します。その強力な regioisomer の 1 つ（C7 置換）は複数の腫瘍細胞における誘導カスパーゼ -3 活性を増強することが知られています。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Akt（Protein Kinase B）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Akt Inhibitor XIV 4-Dodecyl-N-(1,3,4-thiadiazol-2-yl) benzenesulfonamide, PDK1 Inhibitor III, PHT-427	1191951-57-1	409.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	124032-10MG	18,000
	PH（プレクストリン相同）ドメイン（K_d = 40.8 μM、K_i = 2.4 μM）に結合し、PDK1（K_d = 90.1 μM、K_i = 5.5 μM）に対する選択性を持ち、競合的で可逆的な細胞膜への Akt 転座のブロッキング剤として働く細胞透過性のチアジアゾリル化合物。pAkt-Ser473（Panc-1、BxPC-3、MiaPaCa-2 細胞において、IC_{50} = それぞれ 6.3、8.6、10 μM）を阻害し、20 μM（40% ならびに 31%）でアポトーシスを誘発し、それぞれ Panc-1 細胞と MiaPaCa-2 細胞において増殖停止（IC_{50} = 65 と 30 μM）を引き起こします。さらに、腫瘍の増殖とマウス異種移植モデルの退行を抑制し、pGSK-3α-Ser21 や pGSK-3β-Ser9、そして p70S6K-Thr389 レベルを低減します。						
Akt Inhibitor XV, Isozyme-Selective		539.6	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	124034-2MG	50,000
InSolution™ Akt Inhibitor V, Triciribine	35943-35-2	320.3	≥ 95% by HPLC	-70℃		124038-2MG	60,000
Naltrindole, Hydrochloride （NTI）	111469-81-9	451	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O（8 mg/ml）or Methanol（4.5 mg/ml）	476880-5MG	24,000
	細胞透過性のσ選択的オピオイド受容体アンタゴニスト [K_i = 0.031 nM（σ）、3.8 nM（μ）、332.7 nM（κ）]。細胞内 Akt シグナル伝達の阻害剤。PDK1、Akt、FKHR/AFX および GSK-3β の細胞内リン酸化レベルを低下させ、小細胞肺がん（SCLC）細胞株の Akt 依存性細胞増殖を阻害します [IC_{50} = 25 μM（NCI-H69）、40 μM（NCI-H345）、55 μM（NCI-H510）]。						
PDK1/Akt/Flt Dual Pathway Inhibitor （6H-Indeno[1,2-e]tetrazolo[1,5-b][1,2,4]triazin-6-one & 10H-Indeno[2,1-e]tetrazolo[1,5-b][1,2,4] triazin-10-one）		224.2	≥ 98% by HPLC (sum of two isomers)	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	521275-5MG	59,900
	AML（急性骨髄性白血病）において選択的にアポトーシスを誘導する細胞透過性化合物。正常な $CD34^+$ AML 前駆細胞に対してはほとんど影響を与えません。*in vitro* キナーゼアッセイにおいて用量依存的に PDK1 および Akt 活性を直接阻害し、Ser^{473} および Thr^{308} における Akt の細胞内リン酸化を妨げることが示されています。PDK1/Akt および Flt3/PIM シグナル伝達経路を二重に阻害する性質をもつことから、PDK1/Akt 経路のみを目標とする阻害剤に対しては耐性な AML 細胞でも効果的な阻害が可能です（野生型 Flt3、ITD/D835 単一変異体および、Flt3-ITD-TDK 二重変異体をもつ AML について、それぞれ平均 IC_{50} = 1.05、1.91 および 0.43 μM）。						
Serine/Threonine Kinase Inhibitor Set				-20℃		539572-1SET	84,000
Rapamycin	53123-88-9	914.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（25 mg/ml）Ethanol（9 mg/ml）, or Methanol（1 mg/ml）	553210-100UG 553210-1MG 553210-5MG 553210-10MG	11,900 44,900 53,000 103,900
	抗真菌性免疫抑制物質。p70 S6 キナーゼのリン酸化および活性化を選択的に阻害します（IC_{50} = 50 pM）。IGF-II の翻訳活性化を阻止します。さらに $p110^{Rb}$ リン酸化、$p34^{cdk}1$ キナーゼ活性化およびサイクリン A 合成などのシグナリング事象を阻害することが示されています。FK-506 結合タンパク質に対する強い結合を示します。マウス B 細胞株のアポトーシスを誘導し、リンフォカインの誘導による G1 期の細胞増殖を阻害し、G1 期にある酵母 *Saccharomyces cerevisiae* を不可逆的に停止させることが報告されています。						
InSolution™ Rapamycin		914.2	≥ 98% by TLC	-20℃		553211-500UG	27,900
	DMSO にラパマイシン（製品番号 553210）の 5 mM（500 μg/109 μl）溶液。						
InSolution ™ Rapamycin in EtOH		914.2	≥ 98% by HPLC	-70℃		553212-1MG	45,900

AMPK 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
AMPK Inhibitor, Compound C {6-[4-(2-Piperidin-1-yl-ethoxy)-phenyl)] -3-pyridin-4-yl-pyrrazolo[1,5-a]-pyrimidine}	866405-64-3	399.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（4 mg/ml）, 2% HCl（10 mg/ml）, 2% Acetic Acid（10 mg/ml）, or Methanol（3 mg/ml）	171260-1MG 171260-5MG 171260-10MG	18,900 28,000 68,000
	細胞膜透過性のピラゾロピリミジン化合物。AMPK（AMP 活性化プロテインキナーゼ）に対する強力で選択的かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用します（5 μM ATP 存在下・AMP 非存在下での K_i = 109 nM）。ZAPK、Syk、PKCθ、PKA、および JAK3 の活性には影響を与えません。AICAr（製品番号 123040）またはメトホルミンによって誘導される細胞活性を抑制します。マウスにおいて、AMPK 性食物摂取量の低下により体重減少を引き起こします。						
InSolution™ AMPK Inhibitor, Compound C	866405-64-3	399.5	≥ 95% by HPLC	+4℃		171261-1MG	12,000
	AMPK Inhibitor、Compound C（製品番号 171260）の DMSO 溶液。 濃度 10 mM（1 mg/250 μl）。						
InSolution™ AMPK Inhibitor, Compound C・2HCl	866405-64-3	399.5	≥ 98% by HPLC	-20℃		171264-2MG	39,900
STO-609 （7H-Benz[de]benzimidazo[2,1-a]isoquinoline-7-one-3-carboxylic Acid, Acetate; 7-Oxo-7H-benzimidazo[2,1-a]benz[de]isoquinoline-3-carboxylic Acid, Acetate）	52029-86-4	374.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or 100 mM NaOH（20 mg/ml）. May require warming to acheive complete solubilization in DMSO.	570250-5MG	46,900
	細胞透過性のナフトイル融合ベンズイミダゾール化合物。Ca^{2+}/ カルモジュリン依存性プロテインキナーゼキナーゼ（CaM-KK）に対する強力で選択性の高い ATP 競合阻害剤として作用します [IC_{50} = 120 ng/ml（CaM-KKα）、40 ng/ml（CaM-KKβ）]。CaM-KK の触媒ドメインに結合して自己リン酸化を阻害します。CaM-KII、MLCK（IC_{50} 約 10 μg/ml）、CaM-KI、CaM-KIV、PKA、PKC、および p42 MAP キナーゼ（IC_{50} > 10 μg/ml）の活性には著しい影響を与えません。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Aurora Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Aurora Kinase Inhibitor II [4-(4′-Benzamidoanilino)-6,7-dimethoxyquinazoline]	331770-21-9	400.4	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	189404-1MG	23,900
	強力で選択性の高い、ATP 競合的にはたらく Aurora キナーゼの阻害剤（Aurora A、B に対してそれぞれ IC_{50} = 310 nM、240 nM）。水に難溶で血清に結合する性質があるため、*in vitro* でのみ使用可能です。						
Aurora Kinase Inhibitor III [Cyclopropanecarboxylic acid-(3-(4-(3-trifluoromethyl-phenylamino)-pyrimidin-2-ylamino)-phenyl)-amide]	879127-16-9	413.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml) or Ethanol (20 mg/ml)	189405-1MG	25,900
	細胞透過性の 2,4- ジアニリノピリミジン化合物。Aurora A の ATP 競合的かつ強力な、しかし非選択的な阻害剤として作用します（IC_{50} = 42 nM）。高濃度では、Lck、Bmx、IGF-1R および Syk などの他のキナーゼの活性も阻害します（それぞれ IC_{50} = 131、386、591 および 887 nM）。						
Aurora Kinase/Cdk Inhibitor [4-(5-Amino-1-(2,6-difluorobenzoyl)-1H-[1,2,4]triazol-3-ylamino)-benzenesulfonamide]	443797-96-4	435.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (15 mg/ml)	189406-5MG	65,900
	細胞膜透過性の triazolylsulfonamido 化合物。 可逆的、ATP 競合的なキナーゼ阻害剤として機能します。 Aurora キナーゼ、Cdk に特異的。Aurora-A、Aurora-B に対してそれぞれ IC_{50} = 11、15 nM。 Cdk1/B、Cdk2/A、Cdk2/E に対してそれぞれ IC_{50} = 9、4、3 nM。*in vitro*、*in vivo* において抗腫瘍特性を示します。 ヒト癌細胞株に対し IC_{50}=112 - 514 nM、異種移植マウスモデルにおいて（75-100 mg/kg、i.p.）。						
Binucleine 2 [N′-(1-(3-Chloro-4-fluorophenyl)-4-cyano-1H-pyrazol-5-yl)-N,N-dimethyliminoformamide]	220088-42-6	291.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	201125-5MG	27,000
	細胞オーロラ B キナーゼ経路の細胞質分裂機能を阻害する細胞透過性のピラゾロ化合物。哺乳類系が不活発な一方で、20 μM での有糸分裂の *Drosophila* Kc167 細胞におけるセリン 10 のヒストン（H3）リン酸化反応を阻害します。一般的キナーゼ阻害剤としても機能せず、Cdk 依存の有糸分裂への侵入の阻害もしません。						

Calmodulin-Dependent Protein Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Autocamtide-2 Related Inhibitory Peptide [(Ala^{9})-Autocamtide-2; AIP; KKALRRQEAVDAL]		1497.8	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	189480-500UG	34,000
	Autocamtide-2（製品番号 189475）のリン酸化されないアナログです。高度に選択的かつ強力なカルモジュリン依存性プロテインキナーゼ II 阻害剤です（IC_{50} = 40 nM）。[Ala^{286}]-CaM Kinase II Inhibitor 281-301（製品番号 208710）より約 50 倍強力な活性を示します。PKA、PKC、CaM キナーゼ IV には作用を及ぼしません。電子透過性膵島からの Ca^{2+} 誘導性インスリン分泌を抑制します。						
Autocamtide-2 Related Inhibitory Peptide, Myristoylated (Myr-N-KKALRRQGAVDAL-OH; Myristoylated AIP)		1708.1	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	189482-500UG	43,000
	AIP（製品番号 189480）の N 末端がミリストイル化されたものであり、これによって細胞膜透過性が向上しています。						
Autocamtide-2 Related Inhibitory Peptide II (A3K/V10F-AIP; AIP-II; KKKLRRQEAFDAL)		1602.9	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	189484-1MG	28,000
	Ala^{3} および Val^{10} をそれぞれ Lys および Phe で置換した AIP アナログ。カルモデュリン依存性プロティンキナーゼ II（CaMKII）の非常に特異的かつ強力な阻害剤として働きます（IC_{50} = 4.1 nM）。						
Autocamtide-2 Related Inhibitory Peptide II, Cell-permeable (Ac-RQIKIWFQNRRMKWKKKKKLRRQEAFDAL-OH; Ant-A3K/V10F-AIP; Ant-AIP-II)		3873.7	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml), H_2O (1 mg/ml), or 5% Acetic Acid (1 mg/ml)	189485-1MG	58,900
	AIP-II（製品番号 189484）のアミノ末端に融合させたアンテナペディア輸送ペプチド配列を含む、細胞浸透性のカルモデュリン依存性プロティンキナーゼ II（CaMKII）阻害剤。						
Ca^{2+}/Calmodulin Kinase II Inhibitor 281-309 (CaM Kinase II Inhibitor 281-309; MHRQETVDCLKKFNARRKLKGAILTTMLA-OH)		3374.1	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (5 mg/ml)	208711-500UG	31,900
	CaM キナーゼ II の CaM 結合、阻害、および自己リン酸化に関与するドメインを含む合成ペプチド。PKC によって Thr^{286} でリン酸化されます。カルモジュリン結合ペプチドとして有用です。Ca^{2+}/ カルモジュリン活性化を抑制することによって CaM キナーゼ II を阻害します（IC_{50} = 80 nM）。						
Calmodulin Binding Domain (Calmodulin antagonist; CaM kinase II 290-309)	115044-69-4	2274.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O	208734-1MG	30,000
	強力なカルモジュリンアンタゴニスト。カルモジュリン依存性プロテインキナーゼ II の活性化を阻害します（IC_{50} = 52 nM）。偽基質として CaM キナーゼ II の触媒コアと相互作用します。						
Calmodulin Kinase IINtide (KRPPKLGQIGRAKRVVIEDDRIDDVLK-OH)		3115.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	208920-1MG	31,000
	CaMK II の有効で特異的な阻害剤（IC_{50} = 50 nM、総量ならびに Ca^{2+} 非依存性 CaMK II 活性）。ネズミ脳、金魚脳、そして *Drosophila*（IC_{50} 範囲 100-400 nM）を含む converged species を通して阻害活性を示します。CaMK I、CaMK IV、CaMKK、PKA あるいは PKC の活性に影響しません。ペプチド配列は CaMK IIN の阻害ドメインに反応します。						
Calmodulin Kinase IINtide, Myristoylated (Myr-N-GGGKRPPKLGQIGRAKRVVIEDDRIDDVLK-OH)		4698.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	208921-1MG	34,000
	CaMK IINtide（製品番号 208920）のミリストイル化した形状。ペプチドはグリシン 3 残基を追加して末端リシンで修復されており、細胞透過性を向上させるためにミリストイル化されました。						
CaMKII Inhibitor, CK59 2-(2-Hydroxyethylamino)-6-aminohexylcarbamic acid tert-butyl ester-9-isopropylpurine	140651-18-9	435.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	208922-5MG	43,900
	細胞透過性の 3 置換プリンアナログ。3T3-L1 脂肪細胞におけるインスリン刺激グルコース輸送を阻害し（IC_{50}= 約 100 nM）、基礎グルコース取り込みには影響を与えません。カルシウム / カルモジュリン依存性プロテインキナーゼ II（CaMKII）に高い親和性で選択的に結合し、その活性を阻害します（IC_{32} = 100 nM；IC_{55}= 10 μM）。Cdk5 に中程度に結合し、GSK-3、p42/p44-MAPK、RSK2、CKI に弱く結合し、IRb- サブユニット、SHC、PI 3-K p85a,pAkt、Cdk4、Cdk2 には結合しません。						
H-89, Dihydrochloride {N-[2-((*p*-Bromocinnamyl)amino)ethyl]-5-isoquinolinesulfonamide, 2HCl}	127243-85-0	519.3	≥ 99% by HPLC	+4℃	DMSO (200 mg/ml) or H_2O (25 mg/ml)	371963-1MG	23,900
	細胞透過性のプロテインキナーゼ A の選択的かつ強力な阻害剤（K_i= 48 nM）。他のキナーゼははるかに高濃度でのみ阻害します：CaM キナーゼ II（K_i= 29.7 μM）、カゼインキナーゼ I（K_i= 38.3 μM）、ミオシン軽鎖キナーゼ（K_i= 28.3 μM）、プロテインキナーゼ C（K_i= 31.7 μM）、ROCK-II（IC_{50} = 270 nM）。PKA と GEFI、GEFII、Epac（cAMP によって直接活性化される交換タンパク質）などの cAMP 調節性グアニンヌクレオチド交換因子（GEF）の作用を識別するために使用できます。ヒト細胞株 BM 13674 において放射線誘発アポトーシスを促進します。						
HA 1004, Dihydrochloride N-(2-Guanidinoethyl)-5-isoquinolinesulfonamide, 2HCl	92564-34-6	366.3	>98% by TLC	+4℃	H_2O (10 mg/ml)	371964-1MG	14,000
	タンパク質キナーゼ A（K_i = 2.3 μM）、CaM キナーゼ II（K_i = 13 μM）、ミオシン軽鎖キナーゼ（K_i = 150 μM）、タンパク質キナーゼ C（K_i = 40 μM）、タンパク質キナーゼ G（K_i = 1.3 μM）の細胞透過性の可逆的 ATP 競合的阻害剤。心臓機能に効果のない細胞内の Ca^{2+} 受容体拮抗因子。肺高血圧症のとき選択的肺血管拡張を引き起こします。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Calmodulin-Dependent Protein Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
InSolution™ K-252a, *Nocardiopsis sp.*	97161-97-2	467.5	≥ 95% by HPLC	-20℃		420297-100UG	36,900
	K-252a（製品番号 420298）の 1mM DMSO 溶液（100 µg/214µl）。						
K-252a, *Nocardiopsis sp.*	97161-97-2	467.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMF or DMSO（1 mg/ml）	420298-100UG	37,900
	細胞浸透性プロテインキナーゼ阻害剤。CaM キナーゼ II の強力な阻害剤です（K_i= 1.8 nM）。またミオシン L 鎖キナーゼ（K_i= 17 nM）、プロテインキナーゼ A（K_i= 18 nM）、プロテインキナーゼ C（K_i= 25 nM）、およびプロテインキナーゼ G（K_i= 20 nM）も阻害します。NGF 受容体である $gp140^{trk}$ のチロシンプロテインキナーゼ活性の強力な阻害因子として作用する他（IC_{50} = 3 nM）、がん対立遺伝子である *trk* がん遺伝子および関係するニューロトロフィン受容体である $gp145^{trkB}$ および 145^{trkC} のキナーゼ活性を阻害します。Ckd1 および Cdc25c を阻害することによりアポトーシスおよび細胞周期の停止を誘導します。		
KN-62	127191-97-3	721.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO or Methanol（5 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffer just prior to use.	422706-1MG	26,000
1-[N,O-bis-(5-Isoquinolinesulfonyl)-N-methyl-L-tyrosyl]-4-phenylpiperazine I1562	酵素のカルモジュリン結合部位と直接結合する細胞透過性の可逆的な CaM キナーゼ II（K_i = 900 nM、ラット脳 CaM キナーゼ II 用）の選択的阻害剤。また用量依存的に K562 細胞の成長を阻害します。						
KN-93	139298-40-1	501	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	422708-1MG 422708-5MG	27,900 78,000
{2-[N-(2-hydroxyethyl)]-N-(4-methoxybenzenesulfonyl)]amino-N-(4-chlorocinnamyl)-N-methylbenzylamine)}	ラット脳 CaM キナーゼ II の細胞浸透性阻害剤（K_i= 370 nM）。グルコースによって誘導され、フォルスコリンによって刺激される、膵ランゲルハンス島からのインスリン放出を阻害します。プロテインキナーゼ A 活性には顕著な作用を示しません。NIH/3T3 細胞の細胞周期の G_1 期での停止、およびアポトーシスを誘導します。						
KN-92		555	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	422709-1MG	27,900
{2-[N-(4-Methoxybenzenesulfonyl)]amino-N-(4-chlorocinnamyl)-N-methylbenzylamine, Phosphate}	Ca^{2+}/CaM キナーゼ II 阻害剤である KN-93（製品番号 422708）のネガティブコントロールとして有用です。						
KN-93, Water-Soluble		599	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O（5 mg/ml）	422711-1MG	25,900
	CaM kinase II 阻害剤である KN-93（製品番号 422708）の水溶性タイプ。						
InSolution™ KN-93	139298-40-1	501	≥ 95% by HPLC	-20℃		422712-1MG	28,900
	DMSO に KN-93（製品番号 422708）の 5 mM（1 mg/399 µl）溶液。						
PKD Inhibitor, CID755673	521937-07-5	217.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	476495-10MG	25,900
PP1 Analog II, 1NM-PP1	221244-14-0	331.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	529581-1MG	23,900
[4-Amino-1-*tert*-butyl-3-(1′-naphthylmethyl)pyrazolo[3,4-d]pyrimidine; Mutant Kinases Inhibitor II; NM]	細胞透過性の PP1 Analog（製品番号 529579）。変異型キナーゼの強力な ATP 競合阻害剤として作用し、変異体に対して野生型より高い選択性を示します [IC_{50} = 3.2 nM（T339G、c-Fyn-as1）対 1.0 µM（c-Fyn）、4.3 nM（I338G、v-src-as1）対 28 µM（v-src）、5 nM（F80G、CDK2-as1）対 29 µM（CDK2）、8 nM（F89G、CAMK IIα-as1）対 24 µM（CAMKII）、120 nM（T315A、c-Abl-as2）対 3.4 µM（c-Abl）]。膜キナーゼ Ire1 の変異体を活性化することが明らかになっています。						

Casein Kinase（CK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Casein Kinase I Inhibitor, D4476	301836-43-1	398.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（40 mg/ml）	218696-1MG	30,900
[CK1 Inhibitor; 4-(4-(2,3-Dihydrobenzo[1,4]dioxin-6-yl)-5-pyridin-2-yl-1H-imidazol-2-yl)benzamide]	CK1（*S. pombe* に対して IC_{50} = 0.2 µM; CK1δ; に対しては 0.3 µM）および ALK5（IC_{50} = 0.5 µM）の強力かつ比較的特異的な ATP 競合阻害剤として働く、細胞透過性の 3 アリール置換イミダゾロ化合物。p38α MAP キナーゼに対するよりも約 20 倍高い選択性を示し（IC_{50} = 12 µM）、PKB、SGK および GSK-3β を含む、試験した一群のキナーゼの活性には弱い影響しか示しません。H4IIE ヘパトーマ細胞において、FOXO1a の部位特異的リン酸化（Ser322 および Ser325）および核排除を抑制します。IC261（製品番号 400090; CK1 に対する IC_{50} = 2.5 µM）よりも約 10 倍強力であることが示されています。						
Casein Kinase II Inhibitor I	17374-26-4	434.7	Single spot by TLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	218697-10MG	19,900
(CK2 Inhibitor; TBB; TBBt; 4,5,6,7-Tetrabromo-2-azabenzimidazole; 4,5,6,7-Tetrabromobenzotriazole)	カゼインキナーゼ（CK2）（ラット肝臓およびヒト組換え体 CK2 を使用した場合、それぞれ IC_{50} = 900 nM および 1.6 µM）および DYRK（DYRK1a に対する IC_{50} < 1 µM）の非常に選択的な ATP/GTP 競合阻害剤として働く細胞膜透過性のベンゾトリアゾロ化合物。PKA、PKB、PKC、MKK1、Erk2、p38、JNK、Lck、Lyn、Syk などを含む 33 種類のキナーゼを用いて、特異性が示されています。また、HCV（DNA および RNA 基質を使用した場合、それぞれ IC_{50} = 20 および 60 µM）および WNV（DNA および RNA 基質を使用した場合、それぞれ IC_{50} = 1.7 および 900 nM）において、NS3 関連ウイルスヘリカーゼ活性を阻害することが示されています。						
InSolution™ Casein Kinase I Inhibitor, D4476		398.4	≥ 95% by HPLC	-20℃		218705-1MG	31,900
	Casein Kinase I Inhibitor、D4476（製品番号 218696）の 10 mM（1 mg/251 µl）DMSO 溶液です。						
InSolution™ Casein Kinase II Inhibitor I		434.7	Single spot by TLC	+4℃		218708-5MG	14,900
	Casein Kinase II Inhibitor I（製品番号 218697）の DMSO 溶液。濃度 10 mM（5 mg/1.15 ml）。						
Casein Kinase II Inhibitor III, TBCA	934358-00-6	463.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）Use only fresh DMSO.	218710-5MG	32,900
[CKII Inhibitor, TBCA; (E)-3-(2,3,4,5-Tetrabromophenyl)acrylic acid]	細胞透過性の四臭素化ケイ皮酸化合物。Casein Kinase II の強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 110 nM、K_i = 77 nM；CKI に対する IC_{50} > 40 µM）。Casein Kinase II Inhibitor I、TBB（製品番号 218697）および Kinase II Inhibitor II、DMAT（製品番号 218699）よりも優れた阻害剤であることが示されており（それぞれ、CKII に対する IC_{50} = 110 nM、500 nM および 140nM；DYRK1α に対する IC_{50} = 24.5 µM、910 nM および 120 nM；CKII V66A、I174A に対する IC_{50} = 680 nM、12.51 µM および 5.79 µM）、Jurkat 細胞においてアポトーシスを効率よく誘導します（TBCA および TBB について、それぞれ DC_{50} = 7.7 µM および 19.9 µM）。28 種類のキナーゼパネルの中で SGK、GSK-3β、CKI、Cdk2/A、p70S6K および Akt1 をある程度阻害することが示されています（10 µM における残存活性は、それぞれ 27%、28%、48%、54% および 57%；CKII では 3%）。						
Keratinocyte Differentiation Inducer		429.5	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（15 mg/ml）or Ethanol（3 mg/ml）	218713-5MG	43,900
	細胞透過性のピロロ - ピリミドン化合物。表皮始原細胞の最終分化ケラチノサイトへの分化を選択的に誘導します（NHEK における EC_{50} = 100 nM）。ケラチン 1/10、トランス - グルタミナーゼ 1、フィラグリン、p38δ の発現レベルをアップレギュレートし、c-myc レベルを下げます。カゼインキナーゼ II、TANK 結合キナーゼ 1（TBK1）および NIMA 関連キナーゼ 9（NEK9）の α′ および α サブユニットに結合し、ATP 競合的かつ可逆的な CKII 阻害剤として作用します。						

Casein Kinase（CK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Casein Kinase II Inhibitor IV 5-Oxo-5,6-dihydroindolo[1,2-a]quinazoline-7-acetic acid	391670-48-7	292.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	218714-5MG	42,000
	細胞透過性のインドロキナゾリノン化合物。強力かつ選択的な CK2 阻害剤（100 μM ATP 存在下で IC_{50} = 390 nM）として ATP および GTP 競合的に（K_i=0.17 および 0.21 mM）作用します。阻害活性は PI 3-Kα/β/γ（20 μM で阻害活性なし）および広く研究されているプロテインキナーゼ 48 種類に対してはとても低く（100 mM ATP 存在下で IC_{50} ≥ 10 mM）、DYRK1a に対する選択性は TBB（製品番号 218697 および 218708）（100 mM ATP 存在下でそれぞれ IC_{50} <1 および 8 mM）よりも優れています。Jurkat 培養細胞における細胞 HS1 リン酸化を低下させ、多発性骨髄腫細胞株 3 種の増殖停止（80 mM で≥ 70%）を用量依存的に誘発します。					
Casein Kinase I Inhibitor II, PF-670462 4-（3-Cyclohexyl-5-（4-fluorophenyl）-3H-imidazol-4-yl）-pyrimidin-2-ylamine, 2HCl G1493	950912-80-8	410.32	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO or H_2O	218716-5MG	23,900
	EGFR と p38 MAPK（IC_{50} = それぞれ 150 ならびに 190 nM）、43 の関連するキナーゼ（IC_{50} > 0.3 から 30 μM）に対し軽度の選択性から高い選択性を持つカゼインキナーゼ Iε/δ（IC_{50} = それぞれ 7.7 ならびに 14 nM）の有効で可逆的な阻害剤として働く細胞透過性の 3 置換イミダゾール化合物。パネルには受容体 116、輸送体、酵素を含みます。GFP-PER3 ならびに CKI の同時遺伝子導入した COS7 細胞（EC_{50} = 290 nM）において PER3 の核移行を阻害することや、サルやラットモデル（10 - 100 mg、s.c.）のサーカディアンリズムの位相後退を阻害し、さらに、メタンフェタミンに対する運動促進作用反応を弱体化することが示されています。					
Casein Kinase II Inhibitor V, Quinalizarin 1,2,5,8-Tetrahydroxy-9,10-anthraquinone	81-61-8	272.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	218717-50MG	17,900
	細胞透過性の水酸化アントラキノン化合物。強力（IC_{50} = 110 nM）かつきわめて選択的な（CK1 とその他の 83 種類のキナーゼに対する IC_{50} >1 μM）ATP 競合的（K_i= 50 nM）CK2 阻害剤で、TBB（製品番号 218697 および 218708）および DMAT（製品番号 218699 および 218706）と比較して DYRK1a、PIM1/3、および HIPK2 に対しより大きな選択性を示します。細胞 CK2 活性の阻害および Jurkat 細胞培養におけるアポトーシス誘導の効果は、それぞれ TBB の 4.3 倍および 1.9 倍です。					
Casein Kinase II Inhibitor VI, TMCB ERK8 Inhibitor I, 4,5,6,7-Tetrabromo-2-dimethylamino-1-carboxymethyl-benzimidazole, K66	905105-89-7	534.8	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	218718-10MG	16,000
	CK2（IC_{50} = 500 nM; K_i = 250 nM）ならびに ERK8（IC_{50} = 500 nM）に対して非常に選択的な（他の 71 種類のキナーゼ IC_{50} >10 μM ）ATP 競合的阻害剤として働く細胞透過性の ertabromobenzimidazolo TBB（Cat. Nos. 218699 ならびに 218708 類似体。K66 は TBB や DMAT と比べてさらに選択的であることが報告されており、K66 による選択的 CK2 阻害は非 ERK8 発現 Jurkat 細胞に対して細胞毒性があることを示しています。					
Daidzein （4′,7-Dihydroxyisoflavone）	486-66-8	254.2	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	251600-25MG	14,000
	Genistein（製品番号 345834）の不活性型アナログ。カゼインキナーゼ II 活性を阻害することによって、Swiss/3T3 細胞の細胞周期を G_1 期で停止させます。						
5,6-Dichloro-1-β-D-ribofuranosylbenzimidazole （5,6-Dichlorobenzimidazole Riboside; DRB）	53-85-0	319.2	≥ 98% by TLC	room temp.	DMSO（3 mg/ml）or Ethanol（3 mg/ml）. May require warming（47℃ ;C）to achieve complete dissolution.	287891-50MG	24,900
	カゼインキナーゼ II の強力で特異的な阻害剤（IC_{50} = 6 μM）。また、CHO 細胞でインスリン刺激による核および細胞質 p70S6 キナーゼの活性を阻害します。転写を未完に終わらせる作用が報告されています。RNA ポリメラーゼ II の転写がカゼインキナーゼの影響を受けて、阻害されることが報告されています。またウシ受精卵の胚分割を阻害します。G1/S で細胞周期を停止します。						
Ellagic Acid, Dihydrate （4,4′,5,5′,6,6′-Hexahydroxydiphenic Acid 2,6,2′,6′-Dilactone）	476-66-4	338.2	≥ 96% by HPCE	room temp.	1 M NaOH（10 mg/ml）or Ethanol（10 mg/ml）. For complete solubilization in ethanol, slight heating may be required.	324683-500MG	13,900
	抗変異原作用および抗発癌作用を有する強力な抗酸化剤。DNA トポイソメラーゼ I および II を阻害します（それぞれ IC_{50} = 1.8 μM、2.1 μM）。また、PKA 触媒サブユニット（IC_{50} = 2 μM）および PKC（IC_{50} = 8 μM）の強力な阻害剤でもあります。						
InSolution™ H-89, Dihydrochloride N-[2-（（p-Bromocinnamyl）amino）ethyl] -5-isoquinolinesulfonamide, 2HCl		519.3	≥ 99% by HPLC	-20℃		371962-1MG	23,900
	細胞透過性のプロテインキナーゼ A の選択的かつ強力な阻害剤（K_i= 48 nM）。他のキナーゼに対してははるかに高濃度の場合のみ阻害します：CaM キナーゼ II（K_i = 29.7μM）、カゼインキナーゼ I（K_i= 38.3 μM）、ミオシン軽鎖キナーゼ（K_i= 28.3 μM）、プロテインキナーゼ C（K_i= 31.7 μM）、ROCK-II（IC_{50}=270 nM）。PKA と GEFI、GEFII、Epac（cAMP によって直接活性化される交換タンパク質）などの cAMP 調節性グアニンヌクレオチド交換因子（GEF）の作用を識別するために使用できます。ヒト細胞株 BM 13674 において放射線誘発アポトーシスを促進します。						
Hypericin	548-04-9	504.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）, Ethanol（1 mg/ml）or Methanol（1 mg/ml）	400076-1MG	29,000
	抗レトロウイルス活性を示すポリサイクリックジオン。プロテインキナーゼ C を阻害します（IC_{50} = 3.3 μM）。カゼインキナーゼ II（IC_{50} = 6 nM）、MAP キナーゼ（IC_{50} = 4 nM）、インスリン受容体のプロテインチロシンキナーゼ活性（IC_{50} =20-29 nM）および上皮成長因子受容体の活性（IC_{50} = 35 nM）を阻害することも知られています。						
IC261 {3-[（2,4,6-Trimethoxyphenyl）methylidenyl]-indolin-2-one; SU5607}	186611-52-9	311.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）	400090-5MG	34,900
	強力かつ選択的なカゼインキナーゼ（CK1）阻害剤。CK1δ;（IC_{50} = 0.7-1.3 μM）および CK1ε;（IC_{50} = 0.6-1.4 μM）アイソザイムを阻害します。また、より高濃度において CK1α_1 も阻害します（IC_{50} = 11-21 μM）。この阻害作用は ATP に対して競合的です。PKA、$p34^{cdc2}$ および $p55^{fyn}$ に対しては微弱な阻害作用のみを示します（IC_{50}S> 100 μM）。IC261 は、低濃度で細胞質分裂を阻害し、有糸分裂を一時的に停止します。また p53 N-terminus targeted protein kinase も阻害します。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

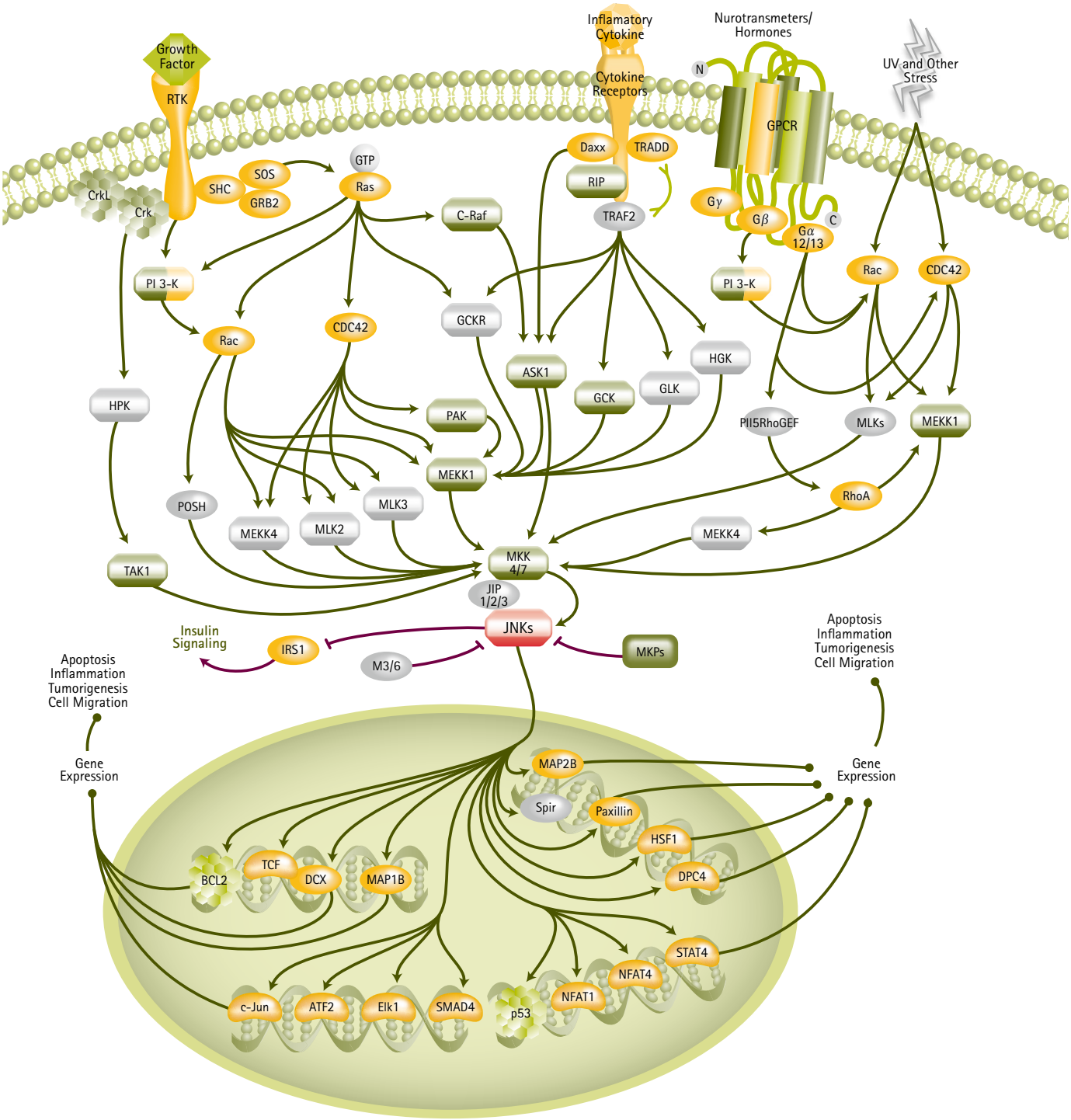
c-Jun N-Terminal Kinase（JNK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
JNK Inhibitor I, (L)-Form, Cell-Permeable		3923.6	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (2 mg/ml)	420116-1MG	40,000
[(*L*)-HIV-TAT_{48-57}-PP-JBD_{20}; (L)-JNKI1; c-Jun NH_2-terminal kinase; H-GRKKRRQRRRPPRPKRPTTLNLFPQVPRSQDT-NH_2; SAPK Inhibitor I]	転写因子 *c-jun* の活性化を阻害して（IC_{50} = 約 1 μM）*c-jun* NH_2 末端キナーゼ（JNK）シグナリングを低下させる細胞浸透性の生物活性ペプチド。この効果は、JNK の活性化ドメインのリン酸化の阻害によると見られています。本品はわずか 20 アミノ酸からなる Islet-Brain（IB）の阻害ドメインを含んでいます。このドメインは、JNK との相互作用に不可欠であり 2 個のプロリン残基をスペーサーとして、10 アミノ酸 HIV-TAT_{48-57} 配列の担体ペプチドと結合しています。インスリン分泌 βTC-3 細胞の IL-1β の誘導による *c-jun* および *c-fos* 発現を阻害し、アポトーシスから保護します。インスリン分泌には影響せず、また ERK 1/2 あるいは p38 活性には作用しません。						
JNK Inhibitor I, (L)-Form, Cell-Permeable, Negative Control		1589.9	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (2 mg/ml)	420118-1MG	30,000
[(L)-HIV-TAT_{48-57}-PP; GRKKRRQRRRPP-NH_2]	HIV-TAT_{48-57} 配列に由来し、2 個のプロリン残基で修飾された、細胞浸透性の高い 10 アミノ酸担体ペプチド。様々な細胞に蓄積することが証明されています。JNK Inhibitor I、(L) -Form、Cell-permeable（製品番号 420116）を用いた研究用のネガティブコントロールとして有用です。						
JNK inhibitor II	129-56-6	220.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (15 mg/ml) . For every 10 μM concentration of JNK Inhibitor II, include 0.1% DMSO in the culture medium. Pre-warming of culture medium and addition of BSA to the medium may enhance its solubility.	420119-5MG 420119-25MG 420119-50MG	18,900 35,000 58,000
[Anthra[1,9-*cd*]pyrazol-6(2*H*)-one; 1,9-pyrazoloanthrone; SAPK Inhibitor II; SP600125]	c-Jun N 末端キナーゼ（JNK）に対する強力、選択的、細胞透過性かつ可逆的阻害剤 [IC_{50} = 40 nM（JNK-1 および JNK-2）、90 nM（JNK-3）]。阻害作用は ATP と競合します。JNK に対して ERK1 および p38-2 MAP キナーゼより 300 倍以上高い選択性を示します。c-Jun のリン酸化を阻害し、IL-2、IFN-γ、TNF-α、および COX-2 の細胞発現を抑制します。IL-1 によるリン酸化 Jun の蓄積および c-Jun 転写の誘導を抑制します。						
JNK Inhibitor II, Negative Control		234.2	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	420123-1MG	15,900
(N^1-Methyl-1,9-pyrazoloanthrone)	JNK Inhibitor II（SP600125、製品番号 420119）のネガティブコントロールとして有用。JNK2 および JNK3 を SP600125 に比べて（それぞれ IC_{50} = 0.04 μM、0.09 μM）、はるかに高い濃度で阻害します（それぞれ IC_{50} = 18 μM、24 μM）。						
InSolution™ JNK Inhibitor II		220.2	≥ 98% by HPLC	-20℃		420128-5MG	17,900
	DMSO に JNK 阻害剤 II（製品番号 420119）の 50 mM（5 mg/454 μl）溶液。						
JNK Inhibitor V	345987-15-7	372.5	≥ 95% by HPLC (sum of two isomers)	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	420129-5MG	26,000
[AS601245; 1,3-Benzothiazol-2-yl-(2-((2-(3-pyridinyl)ethyl)amino)-4-pyrimidinyl) acetonitrile; SAPK Inhibitor V]	細胞膜透過性のピリミジニル化合物。抗炎症性を示します。JNK（c-Jun N- 末端キナーゼ）の強力な選択的阻害剤（ヒト hJNK1、hJNK2、hJNK3 に対してそれぞれ IC_{50} = 150、220、70 nM）。ATP 競合的。他のキナーゼに対しては IC_{50}=1-10 μM か、10 μM でも効果ありません。スナネズミ、マウス、ラットに対する経口、*i.v., i.p* 投与による *in vivo* での有効性が示されています。						
JNK Inhibitor III, Cell-Permeable		4413.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) or Acetic Acid (100 mg/ml)	420130-1MG	49,900
(Ac-YGRKKRRQRRR-gaba-ILKQSMTLNLADPVGSLKPHLRAKN-NH_2; HIV-TAT_{47-57}-gaba-c-Junδ_{33-57}; SAPK Inhibitor III)	細胞膜透過性の 37 mer ペプチド。ヒト c-JUNδ ドメイン（アミノ酸 33-57）配列を、γ- アミノ酪酸（GABA）スペーサーを介して、HIV-TAT タンパク質トランスダクションドメイン（アミノ酸 47-57）の配列に融合させることによって作製。*in vitro* と生細胞中の両方で、c-JUN-JNK 複合体形成、それに続く c-JUN のリン酸化および活性化を特異的に乱すことが示されています。阻害の作用機序が JNK Inhibitor II（SP600125; 製品番号 420119）とは異なるため、これら 2 つの阻害剤は JNK シグナル経路研究において、互いに相補的に使用することができます。						
JNK Inhibitor III, Cell-Permeable, Negative Control		4413.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml)	420131-1MG	49,000
(Ac-YGRKKRRQRRR-gaba-DSNLIRGVLPTLMPKSLAQNKLKHA-NH_2; HIV-TAT_{47-57}-gaba-c-JUNδ_{33-57}, scrambled)	ヒト c-JUNδ; ドメイン（アミノ酸 33-57）のスクランブル配列を、γ- アミノ酪酸（GABA）スペーサーを介して HIV-TAT タンパク質トランスダクションドメイン（アミノ酸 47-57）を連結させた、細胞膜透過性の 37 mer ペプチド。c-JUN と JNK の複合体形成を阻害しないため、JNK Inhibitor III、Cell-Permeable（製品番号 420130）のネガティブコントロールとして働きます。						
JNK Inhibitor VI, TI-JIP 153-163		1341.6	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	420133-2MG	35,000
(H_2N-RPKRPTTLNLF-NH_2; Truncated Inhibitor based on JNK-Interacting Protein 1)	マウス JIP-1 JNK 結合ドメイン（JBD）由来の 11-mer ペプチド。JNK と直接相互作用し（KD は低 μM 範囲）、ERK や p38 に抑制効果を与えることなく、JNK キナーゼ活性を特異的に阻害します。この阻害は JBD を含む基質のみに限られず、混合的で、ATP に関して非競合的であることが明らかになっています。また、JNK Inhibitor VII、TAT-TI-JIP153-163、Cell-Permeable（製品番号 420134）もご利用になれます。						
JNK Inhibitor VII, TAT-TI-JIP 153-163, Cell-Permeable		2883.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	420134-2MG	53,000
(TAT_{38-48} -Truncated Inhibitor based on JNK-Interacting Protein 1; H_2N-YGRKKRRQRRR-RPKRPTTLNLF-NH_2)	非透過性の JNK 阻害ペプチド TI-JIP153-163（製品番号 420133）を N 末端 TAT タンパク質導入ドメイン配列を使って細胞透過性にしたもの。ラット *in vivo* 虚血性脳傷害モデルにおいて、神経保護作用を示すことが明らかにされています。						
JNK Inhibitor VIII	894804-07-0	356.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	420135-5MG	42,900
[N-(4-Amino-5-cyano-6-ethoxypyridin-2-yl)-2-(2,5-dimethoxyphenyl) acetamide]	細胞透過性のピリジニルアミド化合物。JNK の可逆的 ATP 競合阻害剤として作用し（JNK1、2 および 3 に対して、それぞれ K_i = 2 nM、4 nM および 52 nM）、他の 72 種類のキナーゼには影響を及ぼさない優れた選択性を示します。HepG2 細胞における c-jun のリン酸化を EC_{50}=920 nM で阻害します。						
JNK Inhibitor IX	312917-14-9	350.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	420136-5MG	37,000
[N-(3-Cyano-4,5,6,7-tetrahydro-1-benzothien-2-yl)-1-naphthamide]	チエニルナフトアミド化合物。JNK2 および JNK3 の強力な ATP 競合阻害剤として作用し（pIC_{50} = $\log_{10}IC_{50}$；pIC_{50} = 6.5 および 6.7）、JNK1 および p38α には選択性を示します（$pIC_{50} \leq 5.0$ および< 4.8）。アッセイ条件下で SP600125（製品番号 420119）は JNK1、JNK3 および p38α に対し、それぞれ 6.4、5.6 および< 4.8 の pIC_{50} を示します。ALK5、Cdk-2、ErbB2、ERK-2、GSK-3β および PLK1 を含む 30 種類のキナーゼパネルに対しては弱い活性を示します（pIC_{50} < 5.0）。						
JNK Inhibitor X, BI-78D3	883065-90-5	379.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	420140-5MG	18,000
4-(2,3-Dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl) -5-(5-nitrothiazol-2-ylthio)-4H-1,2,4-triazol-3-ol	細胞透過性のベンゾジオキサン - トリアゾール化合物。JNK 相互作用タンパク質 -1（JIP1）の作用を模倣し、JNK 活性の基質競合的・可逆的阻害剤として作用して（IC_{50} = 280 nM、JNK2、JNK2-R127A および JNK2-C162S に対する K_d はそれぞれ 8.1、14.7 および 51.1 μM）、p38a、mTOR および PI3-Ka よりも高い選択性を示します。HeLa 細胞において TNF-α 刺激性の c-Jun リン酸化を阻害し（EC_{50} = 12.4 μM）、ConA 誘導性肝傷害を防止し、マウス 2 型糖尿病モデルにおいてインスリン感受性を回復させます（25 mg/kg、静脈内投与）。						
JNK Inhibitor XI, BI-87G3	2207-44-5	295.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) . Insoluble in Ethanol.	420142-10MG	16,000
2-(5-Nitrothiazol-2-ylthio) benzo[d]thiazole	細胞透過性のベンゾチアゾール化合物。基質結合と競合して JNK キナーゼの活性を阻害しますが（JNK1 による ATF2 リン酸化の IC_{50} = 1.8 μM）、他の 2 種類のキナーゼ（p38a および Akt に対し IC_{50} >100 μM）および 2 種類のプロテアーゼ（フューリンおよび LF に対しそれぞれ IC_{50} >50 および >100 μM）に対してははるかに低い阻害活性を示します。c-Jun 基質を過剰発現している HeLa 培養細胞においてすら、TNF-α 刺激時の細胞 c-Jun リン酸化を効果的に阻止し（IC_{50} = 15 μM）、37° C におけるラットミクロゾーム（$t_{1/2}$ = 70 分）および血漿中（60 分後の残存活性 80%）での安定性アッセイにおいて良好な安定性を示すことが判明しています。						

c-Jun N-Terminal Kinase（JNK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
JNK-3 Inhibitor XII, SR-3576	1164153-22-3	501.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml）	420143-5MG	18,000
3-（4-（3-（3-Methylphenylureido））-1H-pyrazol-1-yl）-N-（3,4,5-trimethoxyphenyl）benzamide	細胞透過性のピラゾロ尿素化合物。ATP 結合ポケットを標的とする強力な JNK3 選択的阻害剤として作用し（IC_{50} = 7 nM）、JNK1 の阻害はるかに高濃度（IC_{50} = 170 nM）に限られ、p38 に対しては 20 μM という高濃度でもほとんど活性を示しません。INS-1 ラット膵臓 β 細胞において、streptozotocin（製品番号 572201）誘発性 c-jun リン酸化を阻害することが判明しています（IC_{50} = 1.3 μM）。						
JNK Inhibitor XIII	40045-50-9	261.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）or Ethanol（4 mg/ml）	420144-10MG	15,000
5-（5-Nitrothiazol-2-ylthio）-1,3,4-thiadiazol-2-amine	pepJIP1（Ti-JIP1153-163）および TAT-pepJIP1（それぞれ製品番号 420133 および 420134）に代わる細胞透過性非ペプチジルチアゾリル - チアジアゾル。JIP 結合部位を標的とする（JNK1 との pepJIP1 結合に対する IC_{50} = 239 nM ）基質競合的（JNK1 による ATF2 リン酸化に対する IC_{50} = 700 nM ）JNK 阻害剤として作用しますが、p38a、Akt、フリンまたは致死因子にはほとんど活性を示しません（IC_{50} >50 μM）。*in vitro* では TNF-α 刺激（IC_{50} = 6.23 μM）による培養 HeLa での過剰発現 GFP-c -Jun のリン酸化を阻害し、*in vivo* では 2 型糖尿病モデルのネズミのインスリン感受性を回復させることが示されています（25 mg/kg の腹腔内投与。ラット肝ミクロソーム試料を用いた生体安定性分析によると、化合物半減期は 37.5℃で 27 分です。						
JNK Inhibitor XIII, SR-3306		490.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	420147-10MG	47,900
JNK Inhibitor XVI, JNK-IN-8		507.6	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	420150-10MG	38,900
Dicoumarol	66-76-2	336.3	≥ 98% by titration	+4℃	0.1 N NaOH（15 mg/ml）or Pyridine（50 mg/ml）	287897-500MG	15,900
[Bishydroxycoumarin; Dicumarol; 3,3′-Methylenebis（4-hydroxycoumarin）]	抗凝固作用を有するキノンリダクターゼ阻害剤。SAPK/JNK 経路と NF-κB 経路を同時に阻害することによって、アポトーシスを促進します。						

JNK Signaling



タンパク質リン酸化・脱リン酸化

阻害剤関連製品の最新情報はこちらから >> www.merckmillipore.jp/sogaizai
ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

Glycogen Synthase Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Alsterpaullone	237430-03-4	293.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（20 mg/ml）	126870-1MG	24,000
[9-Nitro-7,12-dihydroindolo[3,2-d][1]benzazepin-6（5H）-one; 9-Nitropaullone; NSC 705701]	Cdk1/ サイクリン B の強力な阻害剤（IC_{50} = 35 nM）。優れた *in vitro* 抗腫瘍活性を示します。アルツハイマー病において通常 GSK-3β によってリン酸化される部位におけるタウリン酸化を阻害します。また、DARPP-32 の Cdk5/p25 依存性リン酸化も阻害します。						
Alsterpaullone, 2-Cyanoethyl	852529-97-0	346.3	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）. Slight warming may be required for complete solubilization.	126871-1MG	37,000
[3-（6-Oxo-9-nitro-5,6,7,12-tetrahydroindolo [3,2-d][1]benzazepin-2-yl）propionitrile]	Alsterpaullone（製品番号 126870）の誘導体。GSK-3β と Cdk1/cyclin B に対する強力で選択性の高い阻害剤として作用します。ATP 競合的です（GSK-3β、Cdk1/cyclin B に対しそれぞれ IC_{50} = 800 pM 、230 pM）。						
Aloisine A	496864-16-5	267.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	128125-5MG	26,000
[7-*n*-Butyl-6-（4-hydroxyphenyl）[5H] pyrrolo[2,3-b]pyrazine; RP107]	細胞透過性のピロロピラジン化合物。細胞増殖阻害活性を示します。ATP 競合的な可逆性の選択的、強力な阻害剤：cyclin-dependent kinases（Cdks; Cdk1/cyclin B、Cdk2/cyclin A、Cdk2/cyclin E、and Cdk5/p25 に対しそれぞれ IC_{50} = 150 nM、120 nM、400 nM、 200 nM）、glycogen synthase kinase-3（GSK-3; GSK-3α、GSK-3β にそれぞれ IC_{50} = 500 nM、1.5 μM）、c-Jun N-terminal kinase（JNK; IC_{50} ~ 3 - 10 μM）。他のいくつかの酵素に対し弱い阻害も示します（CK1、CK2、MAPKK、PKA、PKG、PKCs、and c-raf に IC_{50} 約 100 μM）。細胞周期を G1 と G2 で停止させる（未分化のテラトカルシノーマ NT2 と分化した後分裂ニューロン hNT に対しそれぞれ IC_{50} = 7 μM、10.5 μM）ことが知られています。						
Aloisine, RP106	496864-15-4	281.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（200 mg/ml）or MeOH（200 mg/ml）	128135-5MG	21,000
[7-*n*-Butyl-6-（4-methoxyphenyl）[5H] pyrrolo[2,3-b]pyrazine; RP106]	細胞透過性のピロロピラジン化合物。細胞増殖阻害活性を示します。ATP 競合的な可逆性の選択的、強力な阻害剤：CDK1/cyclin B、CDK5/p35、GSK-3 に対しそれぞれ IC_{50} = 700 nM、1.5 μM、and 920 nM。						
1-Azakenpaullone	676596-65-9	328.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml）	191500-1MG	25,000
	GSK-3β（IC_{50} = 18 nM）の強力な ATP 競合的阻害剤として働く Kenpaullone（製品番号 422000）アナログ。Cdk1/B および Cdk5/p35 に対するよりも、約 100-200 倍高い選択性を示します（それぞれ、IC_{50} = 2.0 μM および 4.2 μM）。						
Bikinin	188011-69-0	273.1	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	200980-25MG	15,900
4-（（5-Bromo-2-pyridinyl）amino）-4-oxobutanoic acid, Arabidopsis GSK-3 Inhibitor, Arabidopsis SHAGGY-related Kinase Inhibitor, GSK-3-like Kinase BIN2 Inhibitor	細胞透過性非ステロイド性ピリジニルアミド化合物で、シロイヌナズナの GSK3 10 種中 7 種、BIN2 および ASKα/γ/ε/ζ/ι、BIN2、ASK に対する ATP 競合的阻害剤として作用しますが、ASKβ/δ または他の 3 種のシロイヌナズナ Ser/Thr キナーゼ、AtMPK4、AtMPK6 および AtAURORA1 は阻害しません。これに比べて、ヒト Gsk-3β、Aurora B および Aurora C に対する活性ははるかに低く（10 μM Bikinin でそれぞれ 45.6%、69.4%および 42.8%）、他の 74 種のヒトキナーゼにはほとんど、あるいはまったく阻害活性を示さず、アフリカツメガエル胚発生中の GSK-3b 媒介背腹軸形成にも影響しないことから、阻害活性は植物種選択的となります。濃度 30 μM で、BES1 リン酸化の抑制、長い胚軸、長く屈曲した葉柄、羽根型の薄緑色の葉、側方根の低密度など、シロイヌナズナの播種においてブラシノライド（BL）および BRI1 を迂回し、ブラシノステロイド（BR）シグナリング反応を有効に活性化することが示されています。						
Cdk1/2 Inhibitor III	443798-55-8	425.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）, Acetone or THF	217714-1MG	23,900
[5-Amino-3-（（4-（aminosulfonyl）phenyl）amino）-N-（2,6-difluorophenyl）-1H-1,2,4-triazole-1-carbothioamide]	細胞膜透過性のトリアゾロジアミン化合物。各種ヒトがん細胞において抗増殖性を示します（HCT-116、HeLa、A375 細胞に対してそれぞれ IC_{50} = 20 nM、35 nM、92 nM）。Cdk1/cyclin B 、Cdk2/cyclin A に対する選択的で強力な ATP 競合的阻害剤（それぞれ IC_{50} = 600 pM 、500 pM）。他のキナーゼに対する阻害活性は、VEGF-R2（IC_{50} = 32 nM）、GSK-3b（IC_{50} = 140 nM）、他の 8 種類のキナーゼに対して IC_{50} ≥ 1 μM。						
Cdk1/5 Inhibitor	40254-90-8	185.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	217720-5MG	32,000
3-Amino-1H-pyrazolo[3,4-b]quinoxaline	3- アミノ置換ピラゾロキノキサリン化合物で、cyclin-dependent kinases 1、5 の選択的阻害剤（Cdks; Cdk1/cyclin B に IC_{50} = 0.6 μM、Cdk5/p25 に 0.4 μM ）。また GSK-3β を IC_{50} = 1 μM で阻害します。 Cdc25 のフォスファターゼ活性は阻害しません（IC_{50} > 10 μM）。						
Golgicide A	1139889-93-2	284.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	345862-10MG	21,000
6,8-Difluoro-4-pyridin-3-yl-3a,4,5,9b-tetrahydro-3H-cyclopenta[c]quinoline, GCA	細胞透過性のキノリン化合物。シスゴルジ ArfGEF（ADP リボシル化因子 1- グアニンヌクレオチド交換因子）-GBF1（ゴルジ体 brefeldin A 耐性因子 1）の強力かつ特異的な可逆阻害剤として作用します。Arf1 と GBF1 Sec7 ドメインの界面間隙（interfacial cleft）を作用標的とし、ゴルジ体と TGN（トランスゴルジネットワーク）の急速な解離・分散を引き起こしますが、微小管やアクチン細胞骨格には全く作用しません。エンドサイトーシスにより生じた細胞内区画（endocytic compartment）内における毒素の逆行輸送を停止することにより、Vero 細胞における志賀毒素誘導性の細胞毒性に対する保護作用を示す（IC_{50} = 3.3 μM）ことが判明しています。						
GSK-3β Inhibitor I		222.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	361540-5MG	22,000
（TDZD-8; 4-Benzyl-2-methyl-1,2,4-thiadiazolidine-3,5-dione）	非常に選択的な GSK-3β の非 ATP 競合阻害剤として作用する thiadiazolidinone（TDZD）類似体（IC_{50} = 2 μM）。						
GSK-3β Inhibitor II	478482-75-6	395.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	361541-5MG	24,900
[Glycogen Synthase Kinase-3β Inhibitor II; 2-Thio（3-iodobenzyl）-5-（1-pyridyl）-[1,3,4]-oxadiazole]	グリコーゲン合成酵素キナーゼ 3 の強力な阻害剤として働く 2- チオ -[1,3,4]- オキサジアゾール - ピリジル誘導体（IC_{50} = 390 nM）。						
GSK-3β Peptide Inhibitor, Cell-permeable		1464.7	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）or $CH_3CN:H_2O$（1:1）（1 mg/ml）	361546-1MG	36,000
（L803-mts; Myr-N-GKEAPPAPPQSpP-NH_2）	細胞透過性のミリストレイト化した GSK-3β 阻害剤（製品番号 361545）でグリシンスペーサーを含みます。選択的で基質特異的な競合的阻害剤；GSK-3β（IC_{50} = 40 μM）。 Cdc2、PKB、PKC 活性には影響しません。インスリン様作用を持ち、グリコーゲン合成酵素の活性を約 2.5 倍に高めます（HEK293 細胞で）。糖尿病マウスの糖耐性を改善します。*in vivo* で安定。						
GSK-3β Inhibitor VI		318.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）or Ethanol（1 mg/ml）. Use fresh, anhydrous DMSO only.	361547-5MG	26,000
[2-Chloro-1-（4,5-dibromo-thiophen-2-yl）-ethanone]	チエニル α- クロロメチルケトン化合物。GSK-3β に対する細胞透過性の不可逆的な非 ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 1 μM）。本物質は反応性の高いアルキル化剤で、GSK-3β に対する選択性を示し、PKA 活性には 100 μM の高濃度でも影響を与えません。						
GSK-3β Inhibitor VII	99-73-0	277.9	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	361548-5MG	23,000
（α-4-Dibromoacetophenone; Tau Protein Kinase I Inhibitor; TPK I Inhibitor）	フェニル α プロモメチルケトン化合物。細胞透過性の非可逆的、非 ATP 競合的 GSK-3β 阻害剤（IC_{50} = 0.5 μM）。反応性の高いアルキル化試薬で、選択的に GSK-3β に作用し、PKA に対しては 100 μM でも作用しません。						
GSK-3β Inhibitor VIII	487021-52-3	308.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	361549-5MG	23,900
[AR-A014418; N-（4-Methoxybenzyl）-N'-（5-nitro-1,3-thiazol-2-yl）urea]	細胞透過性のチアゾール含有尿素化合物。GSK-3β に対する強力で特異性の高い ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 104 nM; K_i= 38 nM）。本品の特異性は、Cdk2 および Cdk5 を含む 28 種類のキナーゼのパネルテストによって確認されています（IC_{50} > 100 μM）。Tau リン酸化を抑制し、Aβ 誘導細胞死に対する神経細胞保護作用を示すことが明らかになっています。						
GSK-3 Inhibitor IX	667463-62-9	356.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	361550-1MG 361550-10MG	19,000 48,900
[BIO; （2'*Z*, 3'*E*）-6-Bromoindirubin-3'-oxime]	細胞膜透過性のビス - インドロ（インジルビン）化合物。GSK-3α/β に対する非常に強力で選択的かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 5 nM）。本品の特異性は、各種 Cdk[IC_{50} = 83 nM（Cdk5/p25）、300 nM（Cdk2/A）、320 nM（Cdk1/B）、10,000 nM（Cdk4/D1）]、および MAP キナーゼ、PKA、PKC アイソフォーム、PKG、CK、IRTK などのよく研究されている他の様々なキナーゼ（IC_{50} ≥ 10 μM）によって確認されています。BIO による GSK の阻害は、ヒトおよびマウスの ESC（胚性幹細胞）において Wnt シグナル伝達経路の活性化および多能性の維持をもたらすことが明らかになっています。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Glycogen Synthase Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
GSK-3 Inhibitor X		398.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) . Limited solubility in aqueous buffers; serial dilutions in DMSO may be required prior to dilution in buffer.	361551-1MG	24,900
[BIO-Acetoxime; (2′*Z*, 3′*E*)-6-Bromoindirubin-3′-acetoxime]	BIO、GSK-3 inhibitor IX (製品番号 361550) のアセトキシムアナログ。GSK-3α/β (IC_{50} = 0.01 μM) に対して CDK5/p25 (IC_{50} = 2.4 μM)、CDK2/A (IC_{50} = 4.3 μM) および CDK1/B (IC_{50} = 63 μM) より高い選択性を示します。CDK4/D1 および他の様々な関連キナーゼの活性に対して弱い作用を示します (IC_{50} ≥ 10 μM)。また、酵母 (EC_{50} ≥ 0.1 μM) および哺乳類 (EC_{50} = 0.16 μM) のレポーターシステムにおいてアリル炭化水素アゴニストとして作用します。						
InSolution™ GSK-3 Inhibitor IX	667463-62-9	356.2	≥ 97% by HPLC	+4℃		361552-500UG	16,900
	GSK-3 Inhibitor IX (製品番号 361550) の、10 mM (500 μg/140 μl) DMSO 溶液。						
GSK-3β Inhibitor XI	626604-39-5	349.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	361553-1MG	33,000
[3-(1-(3-Hydroxypropyl)-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-3-yl]-4-pyrazin-2-yl-pyrrole-2,5-dione]	細胞膜透過性のアザインドリル - マレイミド化合物。GSK-3β に対する強力かつ特異的な ATP 競合阻害剤として作用します (K_i= 25 nM)。各種 PKC アイソザイムを含む 79 種類のよく研究されているプロテインキナーゼにはほとんど阻害作用を示しません。HEK293 細胞において細胞内グリコーゲン合成酵素活性を上昇させ (EC_{50} = 32 nM)、ヒト肝ミクロソーム (HLM) 中で代謝安定性を示すことが明らかになっています ($t_{1/2}$ > 100 min)。						
GSK-3β Inhibitor XII, TWS119		318.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (200 mg/ml) or Methanol (2 mg/ml)	361554-1MG 361554-5MG	23,000 69,000
(Neurogenesis Inducer, TWS119)	細胞膜透過性のピロロピリミジン化合物。GSK-3β の強力かつ選択的な阻害剤として作用します (IC_{50} = 30 nM)。GSK-3β に高い親和性で結合し (K_d = 126 nM)、Wnt シグナル伝達経路における GSK-3β の下流基質である β- カテニンの濃度を上昇させます。マウス全能性 embryonal carcinoma P19 細胞 [EC；30-40% (1 μM)] および胚性幹細胞 [ESC；50-60% (400 nM)] における神経分化を選択的に誘導することが明らかになっています。						
GSK-3 Inhibitor XIII	404828-08-6	301.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	361555-1MG 361555-5MG	17,900 51,000
[(5-Methyl-1H-pyrazol-3-yl)-(2-phenylquinazolin-4-yl) amine]	アミノピラゾール化合物。GSK-3 の強力な ATP 結合部位阻害剤として作用します (K_i = 24 nM)。						
GSK-3 Inhibitor IX, Control, MeBIO		370.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	361556-1MG	24,900
(1-Methyl-BIO)	GSK-3 Inhibitor IX、BIO (製品番号 361550) の N- メチル化アナログ。細胞膜透過性。不活性なネガティブコントロールとして使用します (Cdk1/B に対して IC > 92 μM 、Cdk5/p25 と GSK-3α/β に対して > 100 μM)。アリール炭化水素受容体 (AhR) の強力なリガンドとして作用し (酵母と hepatoma レポーター系に対してそれぞれ EC_{50} = 20 nM、93 nM)、抗増殖特性を示します。						
InSolution™ GSK-3β Inhibitor VIII		308.3	≥ 95% by HPLC; single spot by TLC	+4℃		361557-5MG	22,900
	GSK-3β Inhibitor VIII (製品番号 361549) の DMSO 溶液。濃度 25 mM (5 mg/649 μl)。						
GSK-3 Inhibitor XV		633.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (6 mg/ml)	361558-1MG	64,900
[(*R*,*S*)-7]	細胞透過性のビリドカルバゾロ - シクロペンタジエニル Ruthenium 化合物。GSK-3 の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し (GSK-3α および GSK-3β に対する IC_{50} = 0.7 nM および 1.1 nM)、PIM-1 キナーゼ (IC_{50} = 6 nM) に対するよりわずかに高い選択性を示します。本品の (R) - エナンチオマー (GSK-3α、GSK-3β および PIM-1 キナーゼに対する IC_{50} = 350 pM、550 pM および 35 nM) は 25 nM で HEK293OT および 1205Lu メラノーマ細胞における β- カテニンのレベルを上昇させて Wnt 経路を活性化し、1 μM でゼブラフィッシュ胚における表現型変化を誘導することが知られています。						
GSK-3 Inhibitor XVI	252917-06-9	465.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	361559-5MG	44,900
6-(2-(4-(2,4-Dichlorophenyl)-5-(4-methyl-1H-imidazol-2-yl)-pyrimidin-2-ylamino) ethyl-amino)-nicotinonitrile	細胞透過性のアミノピリミジン化合物。GSK-3 の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し (GSK-3a および GSK-3b に対する IC_{50} はそれぞれ 10 nM および 6.7 nM)、AMPK、IRTK および PI 3-K などのキナーゼ 20 種類 (IC_{50} > 5 μM) およびキナーゼ以外の酵素数種 (K_d > 5 μM) および受容体 (K_d = 約 4 μM) よりもはるかに高い選択性を示します。グリコーゲンシンターゼ (GS) 活性を刺激し、CHO-IR 細胞およびラット肝細胞におけるブドウ糖濃度を低下させ、げっ歯類 2 型糖尿病モデルにおけるブドウ糖排泄を促進します (30 mg/kg、経口投与)。また膵 β 細胞の複製と生存を促進します。さらに、3T3-L1 細胞において Wnt シグナルを活性化し、細胞質内の遊離 β カテニンを安定化して脂肪生成を阻害します。						
GSK-3β Inhibitor XVIII	1139875-74-3	413.9	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	361562-5MG	25,000
2-(Chloro-4-(4-thiophen-2-yl-pyrimidin-2-ylamino)-phenyl)-(4-methyl-pierazin-1-yl)-methanone	細胞透過性のチエニルピリミジン化合物。GSK-3β を強力かつ可逆的に阻害し (IC_{50} = 64 nM)、65 種類のキナーゼからなるキナーゼパネルにおいて他の酵素よりも高い選択性を示します (濃度 5 μM で 7 種類のキナーゼについて阻害率 75% 以上)。また Wnt シグナル伝達経路を活性化します。濃度 10 μM において HEK293 細胞における β カテニンの核移行を促進し、可逆性不死化マウス b 細胞、すなわち R7T1 (EC_{50} = 1.143 μM)、HIT-T15、および MIN6 細胞の複製を誘導することが判明しています。						
GSK-3 Inhibitor XXII, Compound A		345.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	361563-5MG	26,000
6-Methyl-N-[3-[[3-(1-methylethoxy) propyl] carbamoyl]-1H-pyrazol-4-yl]pyridine-3-carboxamide	通常研究されているほかのキナーゼ 27 種類のパネルに対して活性が少ない、またはほとんどなく、GSK-3α ならびに GSK-3β (IC_{50} = それぞれ 2.3 ならびに 2 nM、ATP0.5 μM が存在する状態) の両方に対して有効な阻害剤として働く細胞透過性ピラゾロピリジン化合物。初代ラット皮質神経細胞培養 (最大 30 μM) *in vitro* ならびにマウス (1 日 1kg 当たり 26 mg 経口投与) *in vivo* の両方で、非 GSK キナーゼにより標的にされているもの以外の GSK 特異的セリン／スレオニン残基における細胞タウのリン酸化反応を選択的に阻害することを示しています。化合物 A の長期経口治療も、FTDP-17 (P301L) 変異体でヒト 4R0N タウを発現する JNPL3 マウスから脳組織において不溶性タウ凝集体形成を最大 70% (1 日 1kg 当たり 26 mg 経口投与) と著しく低減すると報告されています。						
GSK-3 Inhibitor XXIII, 3F8	159109-11-2	286.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	361564-10MG	25,000
5-Ethyl-7,8-dimethoxy-1H-pyrrolo[3,4-c]-isoquinoline-1,3-(2H)-dione	GSK-3β (製品番号 361524) 活性の強力な可逆的 ATP 競合的阻害剤として作用する細胞透過性マレイミド化合物 (10 μM、30 μM および 100 μM ATP の存在下で IC_{50} = 34 nM、67 nM および 304 nM)。Cdk2/A、KDR (阻害剤濃度 5 μM での阻害率それぞれ 71%および 53%) ならびに他の 19 種のキナーゼ (IC_{50}>5 μM) に対してはるかに低い活性を示します。胚のシールド期またはこれより前に使用した場合、*in vitro* で 293T 培養物の細胞 Wnt 経路を強力に活性化し、β- カテニン依存性リポーター転写を促進 (4 μM で 15 倍) するほか、*in vivo* でゼブラフィッシュの前脳の発育を阻止することが示されています。						
GSK3β Inhibitor XIX, IM-12		377.41	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	361565-10MG	24,900
IM-12	同じアッセイ条件における SB-216763 の 92 nM と比較して、*in vitro* 結合アッセイにおける 53 nM の IC_{50} で GSK-3β 阻害剤として働き、濃度 3 μM 時に酵素アッセイにおける GSK-3β 活性を 27% 低減する細胞透過性インドリルマレイミド誘導体ならびに SB-216763 類似体。hNPC (ヒト前駆細胞) 細胞増殖を軽減し、SB-216763 と同じようにST14 細胞の細胞核まわりの β- カテニンを強化することが示されています。さらに、安定化 β- カテニンの効果を擬態し、ルシファラーゼレポーター遺伝子アッセイの TCF 活性を上方調節し、ヒト前駆細胞の分化を向上することができます。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Glycogen Synthase Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
GSK-3 Inhibitor IV, SB-216763	280744-09-4	371.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	361566-10MG	26,900
SB-216763	GSK-3 活性（K_i = 9.1nM、GSK-3α）の有効な、選択的 ATP- 競合的阻害剤として働く細胞透過性（アリール基、インドール）マレイミド化合物。10 μM の濃度では、試験した他の 24 種類のタンパク質キナーゼのパネルはそれほど著しく阻害されません。チャン・ヒト肝細胞（EC_{50} = 3.6 μM）においてグリコーゲン合成を刺激し、HEK293 ヒト胎児腎臓細胞株の β- カテニン -LEF/TCF（リンパ球エンハンサー因子／T 細胞因子）調節レポーター遺伝子の転写を誘発すると報告されています。SK-N-SH ならびに COS-7 細胞におけるポリグルタミン誘発による死から保護し、VSMC ならびに COS-7 細胞における低酸素誘発性アポトーシスを軽減します。肝がん細胞におけるホスホエノールピルビン酸カルボキシキナーゼ（PEPCK）ならびにグルコース 6 ホスフォターゼ（G6Pase）の発現を低減することが示されています。Wnt ／ β- カテニン介在転写活性を通じた CLL リンパ球の生存性を促進します。再潅流時に KATP（ATP 感受性のカリウムチャネル）ならびに MPTP（ミトコンドリア透過性転移細孔）依存性メカニズムを通じてラットモデルの *in vivo* 心保護の遅れが見られます。		
GAG Antagonist, Surfen		499.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	362330-100MG	28,000
NSC12155	負に帯電している硫酸塩ならびにヘパラン硫酸（HS）、ヘパランそしてデルマタン硫酸に存在するカルボン酸部分で静電気相互作用を通じて GAG（グルコサミノグリカン）を結合し、タンパク質結合パートナーと GAG 相互作用を効果的にブロッキングすることができる対称キノリル尿素化合物。サーフェンは、ヘパランの抗凝血活性と同様、Xa 因子活性の HS ／ヘパラン介在トロンビン阻害を効果的に無効化することを示しています。また、マウス胚内皮培養（IC_{50} ~5 μM）、フィブロネクチン HS 結合ドメイン依存性 CHO 細胞粘着（IC_{50} = 3 μM）ならびにグルコサミニル 3-O- スルホトランスフェラーゼ -3A 発現 CHO 細胞の HSV-1 感染（5 μM で完全阻害）において FGF2 誘発性 Erk リン酸化反応ならびにチューブ形成を阻害すると報告されています。有効性が向上したサーフェン類似体は、臨床応用においてプロタミン（製品番号 539122）に代わる低毒性の有望な候補としての役割を果たせるかもしれません。		
Isogranulatimide	244148-46-7	276.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	371957-1MG	37,900
(IGR)	細胞膜透過性のアルカロイド。インドール・マレイミド・イミダゾール骨格をもち、Chk1、GSK-3β に対する強力な阻害剤として ATP 競合的に作用します（それぞれ IC_{50} = 100 nM、500 nM）。Chk1 に対して選択性があります。G2 期チェックポイントキナーゼ、Chk2、Cdk1、DNA-PK に対してそれぞれ IC_{50} = 3 μM、10 μM、10 μM）。他にテストした 11 種類のキナーゼについてはほとんど効果はありません（IC_{50} ≥ 40 μM）。ガンマ線照射と併用すると、P53 の機能を欠損した MCF-7 細胞株の増殖を選択的にブロックします。						
Indirubin-3'-monoxime	160807-49-8	277.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	402085-1MG	30,000
	サイクリン依存性キナーゼの強力な阻害剤（Cdk1 に対して IC_{50} = 180 nM）。広い細胞スペクトルに対し、細胞周期を G_2/M 期にとどめることによって増殖を阻害します。*in vitro* でタウリン酸化を阻害し、*in vivo* ではアルツハイマー疾患に特異的な部位タウリン酸化を阻害します。CdK5 による DARPP-32 の Thr^{75} のリン酸化を *in vivo* で阻害することも報告されています。						
Indirubin-3'-monoxime, 5-Iodo-		403.2	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	402086-1MG	26,000
	グリコーゲンシンセターゼキナーゼ 3β（GSK-3β）の極めて強力な阻害剤（IC_{50} = 9 nM）。Cdk1（IC_{50} = 25 nM）および Cdk5（IC_{50} = 20 nM）の活性も阻害します。インジルビン誘導体は、Cdk と結合する場合と同様に、GSK-3β の ATP 結合ポケットに結合します。GSK-3β と Cdk5 は、大半の場合、アルツハイマー病（AD）における微小管結合タンパク質 Tau の異常な過剰リン酸化の原因となっています。						
Indirubin-3'-monoxime-5-sulphonic acid		357.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	402088-1MG	26,000
	Cdk1（IC_{50} = 5 nM）および Cdk5（IC_{50} = 7 nM）の強力な阻害剤。グリコーゲンシンセターゼキナーゼ 3β（GSK-3β）も阻害します（IC_{50} = 80 nM）。このインジルビン誘導体は、Cdk との結合と同様、GSK-3β の ATP 結合ポケットと結合します。GSK-3β と Cdk5 は、大半の場合、アルツハイマー病（AD）における微小管結合タンパク質 Tau の異常な過剰リン酸化の原因となっています。						
Kenpaullone	142273-20-9	327.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	422000-1MG	24,000
[9-Bromo-7,12-dihydroindolo[3,2-d][1] benzazepin-6(5H)-one; NSC-664704]	サイクリン依存性キナーゼ（Cdk）の強力な細胞浸透性阻害剤。Cdk1/ サイクリン B（IC_{50} = 400 nM）、Cdk2/ サイクリン A（IC_{50} = 680 nM）、Cdk2/ サイクリン E（IC_{50} = 7.5 μM）、および Cdk5/p25（IC_{50} = 850 nM）を阻害します。その他、c-Src（IC_{50} = 15 μM）、カゼインキナーゼ II（IC_{50} = 20 μM）、ERK1（IC_{50} = 20 μM）、および ERK2（IC_{50} = 9 μM）などのキナーゼも阻害します。ATP 結合を競合的に阻害することにより作用します。						
UCN-01	112953-11-4	482.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	539644-500UG	38,900
Ro-31-8220	138489-18-6	553.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	557520-500UG	24,900
{3-[1-[3-(Amidinothio)propyl-1H-indol-3-yl]-3-(1-methyl-1H-indol-3-yl)maleimide; Bisindolylmaleimide IX, Methanesulfonate}	プロテインキナーゼ C（PKC）の競合的阻害剤（IC_{50} = 10 nM）。CaM キナーゼ II（IC_{50} = 17 μM）、プロテインキナーゼ A（IC_{50} = 900 nM）から選択的に作用します。また、MAP キナーゼ・フォスファターゼ 1 の発現の阻害剤、かつ JNK1 の活性化因子アクティベーターです。HL-60 細胞において、PKC への効果とは独立に Raf-1 のリン酸化を阻害し、アポトーシスを誘導します。						

JAK 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
JAK Inhibitor I	457081-03-7	309.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO	420099-1MG	38,900
JAK3 Inhibitor, Negative Control		317.8	≥ 92% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	420112-1MG	35,000
(4-Phenylamino-6,7-dimethoxyquinazoline; WHI-P258)	JAK3 阻害剤（製品番号 420101、420104、420106）のネガティブコントロールとして有用です（IC_{50} > 300 μM）。						
JAK2 Inhibitor IV	1110502-30-1	344.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Ethanol (3 mg/ml)	420139-5MG	35,900
3-Amino-5-(N-tert-butylsulfonamido-4-phenyl) -indazole	アミノインダゾール化合物。野生型 JAK2 および恒常的活性型 V617F 変異体（クローン性真性多血症、本態性血小板増多症、および慢性突発性骨髄線維症患者にしばしば認められる）の双方を強力に阻害するのに対し（IC_{50} はそれぞれ 78 および 206 nM）、JAK3 に対してははるかに低い活性を示します（IC_{50}= 2.93 μM）。						
JAK2 Inhibitor V, Z3	195371-52-9	344.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (10 mg/ml)	420141-10MG	21,900
2-Methyl-1-phenyl-4-pyridin-2-yl -2-(2-pyridin-2-ylethyl)butan-1-one	細胞透過性のピリジニルブタノン化合物。Jak2-WT（野生型）および Jak2-V617F（変異体）の pY1007 をアロステリック阻害するものの（Jak2 を過剰発現する BSC-40 細胞における IC_{50} は約 15 および 28 μM）、Tyk2 および c-Src のリン酸化への影響は無視できる程度です。HEL 細胞において pSTAT3 量を低下させ、細胞周期停止を誘導することが判明しています。さらに、造血コロニー形成を抑制します。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

MAP Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Anthrax Lethal Factor, Recombinant, *Bacillus anthracis*		90000	Single major band by SDS-PAGE	+4℃	Reconstitute in 1 ml sterile, distilled H_2O to a final concentration of 100 µg/ml.	176900-100UG	61,900
	炭疽菌致死因子（LF）は、炭疽菌毒素の 3 つのタンパク質成分のうちの一つであり、MAP キナーゼキナーゼ（MAPKK）ファミリーに属するタンパク質を切断する非常に特異的なプロテアーゼです。						
Apigenin	520-36-5	270.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or hot Ethanol（1 mg/ml）	178278-5MG	10,900
（4′,5,7-Trihydroxyflavone）	低濃度（12.5 µM）において、v- H-*ras* 形質転換 NIH/3T3 細胞の転換した表現型の回復を誘導します。これは、MAP キナーゼ活性の阻害によるものと考えられています。G_2/M 期停止によって悪性腫瘍細胞の増殖を阻害し、形態分化を誘導します。						
Dual Specificity Protein Phosphatase 1/6 Inhibitor, BCI	15982-84-0	317.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	317496-10MG	16,900
NSC 150117	Cdc25B、DUSP3 ／ VHR、DUSP5 または PTP1B に対して活性をほとんど示さない一方、低活性の配置における Dusp1 ならびに Dusp6 をロックすることで Dusp1 ／ CL100 ／ HVH1 ／ MKP1 ／ PTPN10 ／ Dusp6 ／ MKP3 ／ PYST1（それぞれ 57% と 30% 削減、0.21 µg の Dusp6 で 0.21 ならびに 2.1 µg Erk2 誘発性 OMFP 脱リン酸化）の基質結合誘発性 MAPK ホスファターゼ活性に対してアロステリックな阻害剤として働く細胞透過性シクロヘキシルアミン - インダシン化合物。ヒト Dusp1 ならびに Dusp6（EC_{50} = それぞれ 11.5 ならびに 12.3 µM）を過剰発現する HeLa 細胞における細胞 Erk リン酸化反応を効果的に高めることが示されています。ゼブラフィッシュ胚発達中の BCI 処理（5-10 µM）による FGF シグナリング活性は、他の前駆細胞タイプを犠牲にして心筋の前駆細胞集団を拡張し、結果として心臓の拡張に繋がると報告されています。						
ERK Activation Inhibitor Peptide I, Cell-Permeable		1757.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	328000-1MG	35,000
（Ste-MEK1$_{13}$; Ste-MPKKKPTPIQLNP-NH_2）	MEK1（MAPKK）の N 末端領域に対応する細胞浸透性のステアリン酸化 13 アミノ酸ペプチド。ERK 活性化および ELK1 転写活性の特異的阻害剤として作用します。						
ERK Activation Inhibitor Peptide II, Cell-Permeable		3146.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	328005-1MG	46,000
（H-GYGRKKRRQRRR-G-MPKKKPTPIQLNP-NH_2; MTP_{TAT}-G-MEK1$_{13}$）	グリシンリンカーを介して HIV-TAT 膜転位ペプチド（MTP）配列と融合させた、MEK1（MAPKK）の N 末端領域に対応する 13 アミノ酸ペプチド。						
ERK Inhibitor		328.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	328006-5MG	23,900
[3-（2-Aminoethyl）-5-（（4-ethoxyphenyl）methylene）-2,4-thiazolidinedione, HCl]	細胞膜透過性のチアゾリジンジオン化合物。抗増殖性を示します（HeLa、A549、SUM-159 細胞に対して $IC_{50} \leq 25$ µM）。ERK2 に選択的に結合し（K_d = 約 5 µM）ERK2 のタンパク基質との相互作用を阻害します。HeLa 細胞内での ERK を介したリボソーム S6 キナーゼ 1（RSK-1）や Elk-1 のリン酸化をブロックしますが、MEK1/2 による ERK1/2 のリン酸化はブロックしません。						
ERK Inhibitor II, FR180204	865362-74-9	327.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	328007-1MG	38,900
[5-（2-Phenyl-pyrazolo[1,5-a]pyridin-3-yl）-1H-pyrazolo[3,4-c]pyridazin-3-ylamine]	ERK1 及び ERK2 の強力な ATP 競合阻害剤（それぞれ IC_{50} = 510 nM、330 nM; K_i= 310 nM、140 nM）。p38α（IC_{50} = 10 µM）よりも約 20 倍、IKKα、MEK1、MKK4、PDGFRα、PKCα、Src、Syk（IC_{50} > 30 µM）よりも約 60 倍高い選択性を示します。細胞膜透過性ピラゾロピリダジンアミン。Mv1Lu 上皮細胞での TGF-β 誘導 AP-1 活性化を阻害（IC_{50} = 3.1 µM）することが示されています。ネガティブコントロールとして、ERK Inhibitor II、Negative Control（製品番号 328008）もあります。						
ERK Inhibitor II , negative control		328.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	328008-1MG	39,000
[5-（2-Phenyl-pyrazolo[1,5-a]pyridin-3-yl）-1H-pyrazolo[3,4-c]pyridazin-3-ol]	$C_{18}H_{12}N_6O$						
ERK Inhibitor III		318.3	≥ 85% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	328009-5MG	25,900
	細胞透過性のフラニルニトロアミノグアニジン ERK 結合性化合物（約 13 µM の KD）。ERK の ATP 結合部位ではなく、基質結合部位を標的とした阻害剤として作用します。HeLa 細胞において ERK の基質である Rsk-1 および Elk-1 の EGF 刺激細胞リン酸化を選択的に阻害します。ERK1/2 の基質や、p38 の基質である ATP-2 のアニソマイシン誘導性リン酸化は阻害しません。						
InSolution ERK InhibitorII, FR180204	865362-74-9	327.3	≥ 97% by HPLC	-20℃		328010-500UG	28,900
Hsp25 Kinase Inhibitor		1396.7	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO or H_2O	385880-1MG	23,000
（KKKALNRQLGVAA; MAPKAP Kinase-2 Inhibitor; MK2 Inhibitor）	哺乳類熱ショックタンパク質（Hsp25）キナーゼ［別名：マイトジェン活性化プロテインキナーゼ活性化プロテインキナーゼ 2（MAPKAP キナーゼ 2）］に対する選択的かつ強力な阻害剤として作用する 13 アミノ酸残基ペプチド。基質ペプチドと競合的に阻害します（K_i= 8.1 µM）。また ATP とは非競合的に阻害します（K_i= 134 µM）。						
MEK1/2 Inhibitor IV	212631-67-9	557.6	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	444967-5MG	19,300
2-（2-Chloro-4-iodo-phenylamino）-N-cyclopropylmethoxy-3,4-difluoro-5-bromo-benzamide	血液脳関門透過性かつ経口投与可能なヒドロキサム酸化合物。MEK1/2 の強力かつ可逆的な ATP/MEK 非競合的阻害剤として作用し（IC_{50} = 10 - 100 nM）、JNK、MAPK2/ERK2、SAPK2α、SAPK2β,SAPK3、および SAPK4 を含む関連するキナーゼ 27 種類と比較してはるかに高い選択性を示します（IC_{50} > 10 µM）。Hep3B、HepG2、PLC and SKHep 細胞において増殖停止とアポトーシスを誘導し（1 - 20 µM）、マウス異種移植モデルにおいて腫瘍形成遅延と腫瘍増殖速度の低下をもたらし（300 mg/kg、口胃経管投与）、PD98059（製品番号 513000）および U0126（製品番号 662005）と比較してより効率的に pERK1/2 を阻害するとの報告があります。さらに、グルコース欠乏 143B、HepG2、HeLa、および星状細胞において ATP シンターゼ複合体を阻害し細胞死を引き起こします（5 µM で約 50%）；マウスうつ病モデルにおいて抑うつ様作用を生じます（30 mg/kg、腹腔内投与）。						
MNK1 Inhibitor	522629-08-9	244.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（15 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	454861-5MG	32,000
[4-Amino-5-（4-fluoroanilino）-pyrazolo[3,4-d] pyrimidine]	細胞透過性のピラゾロピリミジン化合物。マイトジェン活性化プロテインキナーゼ相互作用性キナーゼ 1（MNK1）の選択的阻害剤として作用し（IC_{50} = 2.2 µM）、p38、JNK1、ERK1/2、PKC および Src 様キナーゼは阻害しません。MNK1 による eIF4E のリン酸化を 293 ヒト胎児腎細胞において効果的に阻害することから（IC_{50} = 3 µM）、MNK1 が媒介する細胞シグナル伝達の研究ツールとして有用です。						
MK2a Inhibitor	41179-33-3	349.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	475863-5MG	45,900
[CMPD1; 4-（2′-Fluorobiphenyl-4-yl）-N-（4-hydroxyphenyl）-butyramide; MAPKAPK2a Inhibitor; Mitogen-activated protein kinase-activated protein kinase 2a Inhibitor]	p- アミドフェノール化合物。p38α による MK2a（mitogen-activated protein kinase-activated protein kinase 2a）のリン酸化を選択的かつ非 ATP 競合的に阻害します（K_{iapp}</= 330 nM）。他の 2 種類の既知の p38 基質（MBP および ATF-2）に対する p38α のリン酸化は阻害しません。						
MK-2 Inhibitor III	1186648-22-5	358.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	475864-5MG	44,900
2-（2-Quinolin-3-ylpyridin-4-yl-1,5,6,7-tetrahydro-4H-pyrrolo-[3,2-c]pyridin-4-one	細胞透過性のピロロピリジニル化合物。MK-2 の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し（IC_{50}= 8.5 nM）、11 種類の他のキナーゼに対するより高い選択性を示します（MK-5、MK-3、ERK2、MNK1 および p38α に対する IC_{50}= 81 nM、210 nM、3.44 µM、5.7 µM および > 100 µM、MSK1、MSK2、Cdk2、JNK2 および IKK-2 に対する IC_{50}> 200 µM）。U937 細胞において IC_{50}= 4.4 µM で TNF-α 産生を抑制することが知られています。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

MAP Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
p38 MAP Kinase Inhibitor III	581098-48-8	404.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	506121-1MG	33,900
{(RS)-{4-[5-(4-Fluorophenyl)-2-methylsulfanyl-3H-imidazol-4-yl]pyridin-2-yl}-(1-phenylethyl) amine]; ML3403}	細胞透過性のメチルスルファニルイミダゾール化合物で、強力で選択的な、p38 MAP キナーゼの ATP 部位特異的阻害剤 (IC_{50} = 0.38 µM for p38α)。LPS 刺激によるサイトカイン産生を *in vitro* と *in vivo* で抑制します。ヒト PBMC で IC_{50} = 0.16µM (TNF-α)、0.039 µM (IL-1β)、マウス *in vitro* で ED_{50} = 1.33 mg/kg (TNF-α)。SB 203580 (製品番号 559389 and 559398) と比較しチトクローム P450-2D6 アイソフォームに対する阻害が低く、したがって *in vitro* での使用により適しています。						
p38 MAP Kinase Inhibitor	219138-24-6	365.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml)	506126-500UG	27,900
[2-(4-Chlorophenyl)-4-(4-fluorophenyl) -5-pyridin-4-yl-1,2-dihydropyrazol-3-one]	強力な p38 キナーゼ阻害剤 (IC_{50} = 35 nM)。						
InSolution™ p38 MAP Kinase Inhibitor III		404.5	≥ 98% by HPLC	+4℃		506148-1MG	34,900
	DMSO に p38 MAP キナーゼ阻害剤 (製品番号 506121) の 10 mM (1 mg/247 µl) 溶液。						
p38 MAP Kinase Inhibitor IV	1638-41-1	456.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (4.5 mg/ml)	506153-10MG	30,000
2,2'-Sulfonyl-bis-(3,4,6-trichlorophenol)	細胞透過性の対称スルホン化合物。P38α/β MAPK の強力な ATP 競合阻害剤として作用しますが(それぞれ IC_{50} = 130 および 550 nM)、p38γ/δ、ERK1/2 および JNK1/2/3 に対する阻害はかなり低いです(1 µM での阻害率 23%以下)。hPBMC からの LPS 誘導 IL-1β 放出の阻害については、SB203850 (製品番号 559389、559395、および 559398) よりも有効であることが示されています (100 µM の場合、各 SB 203850 阻害率 50%に対して本阻害剤は 100%)。						
p38 MAP Kinase Inhibitor V	271576-77-3	353.9	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	506156-1MG	41,000
[4-(3-(4-Chlorophenyl)-5-(1-methylpiperidin-4-yl)-1H-pyrazol-4-yl) pyrimidine; SC-409]	細胞透過性の 3 置換ピラゾール化合物。ATP 競合 p38 MAPK 選択的阻害剤として作用します(α、β、γ および δ; に対する IC_{50} = 40 nM、2.3 µM、> 100 µM および > 100 µM)。CK1d を強力に阻害し (IC_{50} = 20 nM)、50 パネルキナーゼにおいて JNK および IκB-a の活性に弱い影響を与えます。単球において LPS 誘導 TNF-α 産生を抑制し (IC_{50} = 40 nM)、Th1 CD4+ 細胞において IL-12 および IL-18 刺激 IFN-γ 産生を抑制します (IC_{50} 約 100 nM)。マウスモデルにおいて心保護作用を示し破骨細胞分化を抑制することが報告されています。						
p38 MAP Kinase Inhibitor VI, JX401	349087-34-9	355.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (26 mg/ml) or Ethanol (17 mg/ml)	506157-5MG	38,000
N-(2-Methoxy-4-thiomethyl) benzoyl-4-benzylpiperidine	細胞透過性のピペリジンアミド化合物。p38 MAPK の強力かつ選択的な可逆的阻害剤として作用し (p38α および p38γ に対する IC_{50} = 32 nM および > 10 µM)、ATP および基質に関して非競合的な阻害作用を示します。P38α を発現した酵母の成長を PD 169316 (製品番号 513030) および SB 203580 (製品番号 559389) よりはるかに効率よく回復させることが知られています。また、L8 筋芽細胞の分化および Elk1 のリン酸化を阻害します。						
p38 MAP Kinase Inhibitor VII, SD-169	1670-87-7	160.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	506158-10MG	30,900
Indole-5-carboxamide	経口投与可能な細胞透過性のインドール化合物。抗糖尿病作用を示します。P38α MAPK の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し (IC_{50}= 3.2 nM)、p38β (IC_{50}= 122 nM) に対するより高い選択性を示し、p38γ、ERK2、JNK-1、MAPKAPK-2 に対しては 50 µM で弱い活性を示します。P38α および HSP60 の発現をダウンレギュレートし、非肥満糖尿病マウスモデル (200 ～ 600 mg/kg、粉末飼料中) において膵島炎および β 細胞破壊を軽減することが知られています。						
p38 MAP Kinase Inhibitor IX	630106-85-3	411.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	506161-2MG	34,400
N-(Isoazol-3-yl)-4-methyl-3-(1-phenyl-1H-pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-4-ylamino) benzamide	細胞透過性の経口投与可能なピラゾロ - ピリミジン化合物 (IC_{50}：5 nM、K_i= 0.2 nM)。強力かつ可逆的な p38α MAPK の阻害剤です。ERK、MK-2、PKC および CYP450 アイソザイム類 (IC_{50} = 30 µM 超) など 20 種類以上の関連キナーゼに比べて 1,000 倍高い選択性を示します。PBMC およびマウスモデルの両者において LPS 誘発性の TNF-α 産生を抑制します (PBMC での IC_{50}=6 nM、マウスモデルへの投与量 5 mg/kg、経口)。						
p38 MAP Kinase Inhibitor VIII	321351-00-2	415.7	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml) or Ethanol (15 mg/ml)	506163-5MG	28,000
(4-((2-Amino-4-bromophenyl) amino) -2-chlorophenyl)-(2-methylphenyl) methanone	p38γ、p38δ;、Erk1/2、JNK1 を含むその他 57 種類のキナーゼのパネルに対してほとんど活性がなく、p38α ならびに p38β2 (それぞれ 82% ならびに 93% 阻害、阻害剤 1 µM；IC_{50} の p38α 阻害 = 40 nM) に対して有効な ATP 結合ポケット標的阻害剤として働く細胞透過性アミノベンゾフェノン化合物。ヒト PBMC *in vitro* における LPS 誘発性サイトカイン生成を阻害し、急性と慢性両方の皮膚炎のマウスモデルで *in vivo* 有効性を示しています。						
p38 MAP Kinase Inhibitor X, BIRB 796	285983-48-4	527.7	≥ 99% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	506172-10MG	18,900
PD 98059	167869-21-8	267.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (20 mg/ml) or Methanol (0.7 mg/ml)	513000-5MG 513000-10MG 513000-25MG	20,000 28,000 103,000
(2'-Amino-3'-methoxyflavone)	MAP キナーゼキナーゼ (MEK) の選択的な細胞浸透性インヒビター。MAP キナーゼの活性化とそれに続く MAP キナーゼ基質のリン酸化を阻害することによって作用します。PD 98059 で PC-12 細胞を前処理すると、神経成長因子 (NGF) により生じる MAP キナーゼ活性の 4 倍の増加が完全にブロックされます (IC_{50} = 2 µM)。しかし、$p140^{crk}$ レセプターまたはその基質 Shc の NGF 依存性チロシンリン酸化には影響せず、PI 3- キナーゼの NGF に依存的な活性化も妨げません。TNF-α 遺伝子発現の LPS 誘導性の活性化をブロックします。*ras* 形質転換 BALB 3T3 マウス繊維芽細胞およびラット腎臓細胞の細胞増殖を阻害し、トランスフォーメイション (がん化) を逆転させます。						
PD 169316	152121-53-4	360.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	513030-1MG	27,900
[4-(4-Fluorophenyl)-2-(4-nitrophenyl)-5-(4-pyridyl)-1H-imidazole]	細胞浸透性の強力な選択的 p38 MAP キナーゼ阻害剤 (IC_{50} = 89 nM)。PD 169316 により p38 MAP キナーゼを阻害すると、非神経および神経細胞株における栄養因子の枯渇によって誘導されるアポトーシスを妨げます。						
SB 202474		279.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml) or methanol	559387-1MG	27,900
[4-Ethyl-2(p-methoxyphenyl)-5-(4'-pyridyl)-IH-imidazole]	MAP キナーゼ阻害の研究に有用なネガティブコントロール。						
SB 202190	152121-30-7	331.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	559388-1MG	26,900
[FHPI; 4-(4-Fluorophenyl)-2-(4-hydroxyphenyl) -5-(4-pyridyl) 1H-imidazole]	p38 MAP キナーゼの細胞浸透性かつ強力な阻害剤。ミエリン塩基性タンパク質 (MBP) の p38 リン酸化を阻害しますが、ERK または JNK MAP キナーゼサブグループの活性には影響しません。また、p38β のキナーゼ活性 (*in vitro* では IC_{50} = 16 nM、細胞中では 350 nM) および、ATF-2 (Activating Transcription Factor 2) の p38 リン酸化を阻害します (IC_{50} = 280 nM)。LPS が誘導する TNF-α およびインターロイキンの生合成をブロック。Hep52 細胞において LDL 受容体の発現を誘導すると報告されています。						
SB 203580	152121-47-6	377.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (30 mg/ml)	559389-1MG 559389-5MG 559389-10MG	26,900 47,000 87,000
[4-(4-Fluorophenyl)-2-(4-methylsulfinylphenyl) -5-(4-pyridyl) 1H-imidazole]	非常に特異的かつ細胞浸透性の p38 MAP キナーゼ阻害剤 (*in vitro* では IC_{50} = 34 nM、細胞中では 600 nM)。*in vivo* において IL-1、細胞性ストレス、および細菌内毒素に反応して生じる MAPKAP キナーゼ 2 の活性化を抑制し、熱ショックタンパク質 27 (HSP27) のリン酸化を妨げます。MAP キナーゼホモログの JNK および p42 MAP キナーゼは阻害しません。LPS で刺激されたヒト単核細胞およびヒト単核細胞細胞株 THP-1 からの IL-1 および TNF-α 産生を阻害します (IC_{50} = 50-100 nM)。PC12 細胞における骨形態形成タンパク質誘導性神経突起成長を阻害します。また、コラーゲンまたはトロンボキサン類似体 U-46619 (製品番号 538944) が引き起こす血小板凝集も阻害します (IC_{50} = 0.2-1.0 µM)。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

MAP Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
SB 202190, Hydrochloride		367.8	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO or slightly soluble in H_2O (0.5 mg/ml)	559393-1MG	27,900
[4-(4-Fluorophenyl)-2-(4-hydroxyphenyl)-5-(4-pyridyl) 1H-imidazole, HCl]	強力な p38 MAP キナーゼ阻害剤 SB 202190（製品番号 559388）の水溶性タイプ。						
SB 203580, Hydrochloride		413.9	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO or H_2O (10 mg/ml)	559395-1MG	23,000
[4-(4-Fluorophenyl)-2-(4-methylsulfinylphenyl)-5-(4-pyridyl) 1H-imidazole, HCl]	強力な p38 MAP キナーゼ阻害剤 SB 203580（製品番号 559389）の水溶性タイプ。						
SB 220025	165806-53-1	338.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (22 mg/ml)	559396-500UG	35,000
[5-(2-Amino-4-pyrimidinyl)-4-(4-fluorophenyl)-1-(4-piperidinlyl) imidazole]	ヒト p38 MAP キナーゼ(MAPK)の強力かつ特異的な阻害剤(IC_{50} = 60 nM)。ERK(p42/p44 MAP キナーゼ)に比べ 2,000 倍、PKA に比べ 500 倍、PKC に比べ 50 倍、EGFR に比べ 1,000 倍以上の選択性を p38 MAPK に対し示します。また、血管新生の強力な阻害剤として、および TNF-α 合成の阻害剤として作用します。						
InSolution™ SB 202190	152121-30-7	331.1	≥ 98% by HPLC	-20℃	A 1 mg/ml solution of SB 202190 (Cat. No. 559388) in anhydrous DMSO.	559397-1ML	28,900
	無水の DMSO に SB 202190（製品番号 559388）の A 1 mg/ml 溶液。						
InSolution™ SB 203580		377.4	≥ 98% by HPLC	-20℃		559398-1ML	19,000
	無水 DMSO に SB 203580（製品番号 559389）の 1 mg/ml 溶液。						
SB 203580, Sulfone	152121-46-5	393.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml)	559399-1MG	27,000
[4-(4-Fluorophenyl)-2-(4-methylsulfonylphenyl)-5-(4-pyridyl)-1H-imidazole]	p38 MAP キナーゼ阻害剤 SB 203580（製品番号 559389）のスルホン類似体。p38 キナーゼを強力に阻害し（IC_{50} = 30 nM）、また、ヒト単核細胞における IL-1 の生産を阻害します（IC_{50} = 200 nM）。						
SB 203580, Iodo-		485.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	559400-1MG	27,000
[4-(3-Iodophenyl)-2-(4-methylsulfinylphenyl)-5-(4-pyridyl) 1H-imidazole]	極めて特異的かつ強力な p38 MAP キナーゼ阻害剤。親化合物である SB 203580（製品番号 559389）と類似の阻害能力を示します。p38 MAP キナーゼ中の阻害剤結合部位の同定に有用です。						
SB 239063		368.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (0.5-1 mg/ml) . May require slight warming to achieve complete solubilization.	559404-500UG	28,900
[*trans*-1-(4-Hydroxycyclohexyl)-4-(4-fluorophenyl)-5-(2-methoxypyrimidin-4-yl) imidazole]	強力な MAP キナーゼ阻害物質です（組換え精製ヒト p38α に対して IC_{50} = 44 nM）。LPS 刺激性ヒト末梢血単球において、IL-1 産生（IC_{50} = 20 nM）、TNF-α 産生（IC_{50} = 350 nM）を阻害します。						
SC-68376	318480-82-9	236.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (200 mg/ml)	565625-1MG	33,000
[2-Methyl-4-phenyl-5-(4-pyridyl) oxazole]	p38 MAP キナーゼ活性を用量依存的、選択的かつ強力に阻害します（IC_{50} = 2-5 μM）。基底状態の ERK または IL-1 誘導性の JNK 活性は阻害しません。						
Tpl2 Kinase Inhibitor	871307-18-5	404.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	616373-1MG	36,900
[4-(3-Chloro-4-fluorophenylamino)-6-(pyridin-3-yl-methylamino)-3-cyano-[1,7]-naphthyridine]	細胞透過性のナフチリジン化合物。Tpl2 キナーゼの強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用します(IC_{50} = 50 nM)。他の関連するキナーゼに比べ、かなりの選択性を示します（EGFR、MEK、MK2、p38、Src および PKC に対して、それぞれ IC_{50} = 5、＞ 40、110、180、＞ 400 および＞ 400 μM)。初代培養ヒト単球と全血の両方において LPS が誘導する TNF-α 生産を阻害することが示されています（それぞれ IC_{50} = 700 nM および 8.5 μM)。						
Tpl2 Kinase Inhibitor II	1186649-59-1	390.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml) or Ethanol (1 mg/ml)	616404-1MG	29,900
4-(Cycloheptylamino)-6-(pyridin-3-yl-methylamino)-3-cyano-[1,7]-naphthyridine,	EGFR、Src、MEK、p38、PKA、PKC、S6 に対する活性（IC_{50} >20 μM）がほとんどない、有効な ATP 競合 Tp12 阻害剤（IC_{50} = 160 nM）として働く、細胞透過性ナフチリジンシクロヘキシル Tpl2 キナーゼ阻害剤（製品番号 616373）類似体。*In vitro*（IC_{50} = 0.5 ならびに 4.5 μM、それぞれヒト単球と全血を使用）と *in vivo*（10 mg/kg、i.p.）のラットにおいて LPS 誘発性 TNF-α 生成を防ぐことが報告されています。						
AG 126	118409-62-4	215.21	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMF or DMSO (5 mg/ml)	658452-5MG	27,000
[α-Cyano-(3-hydroxy-4-nitro) cinnamonitrile]	マウス腹腔マクロファージにおいて、腫瘍壊死因子 -α（TNF-α）および一酸化窒素のリポ多糖（LPS）誘導性合成を阻害します。$p42^{MAPK}$/ERK2 タンパク質基質の LPS 誘導性チロシンリン酸化を抑制します。カラゲニン投与ラットの肺における iNOS および COX-2 の発現を低下させます。ヒト羊膜細胞におけるグルココルチコイド誘導性 COX-2 活性を抑制します（IC_{50} = 15.38 μM)。						
U0126	109511-58-2	403.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml)	662005-1MG 662005-5MG 662005-10MG 662005-20MG	14,000 32,000 41,000 137,000
[1,4-Diamino-2,3-dicyano-1,4-*bis*(2-aminophenylthio) butadiene]	MEK1（IC_{50} = 72 nM）と MEK2（IC_{50} = 58 nM）の強力かつ特異的な阻害剤。この阻害は MEK 基質、ATP および ERK に関して非競合的です。他のキナーゼ（たとえば Abl、Cdk2、Cdk4、ERK、JNK、MEKK、MKK-3、MKK-4/SEK、MKK-6、PKC、Raf など）には、ごくわずかな効果しか示しません。また、T 細胞の活性化やトレランスの誘導に影響することなく、IL-2 の合成および T 細胞の増殖を効果的にブロックする免疫抑制剤として作用します。						
U0124		226.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	662006-1MG	19,900
[1,4-Diamino-2,3-dicyano-1,4-*bis*(methylthio) butadiene]	MEK 阻害剤 U0125（製品番号 662008）および U0126（製品番号 662005）のネガティブコントロールとして有用です。MEK 活性は 100 μM の濃度でも阻害しません。						
InSolution ™ U0126	109511-58-2	403.5	≥ 98% by HPLC	-70℃		662009-5MG	60,900
ZM 336372	208260-29-1	389.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml)	692000-1MG	35,900
{N-[5-(3-Dimethylaminobenzamido)-2-methylphenyl]-4-hydroxybenzamide}	強力かつ特異的なプロテインキナーゼ c-Raf の阻害剤(IC_{50} = 70 nM)。B-Raf に比べ、10 倍高い効力で c-Raf を阻害しますが、SAPK2α/p38α(IC_{50} = 2 μM）と SAPK2β/p38β2（IC_{50} = 2 μM）を除き、他の多くのプロテインキナーゼは 50 μM の濃度でも阻害しません。ZM 336372 による c-Raf の阻害は、ATP に関して競合的です。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

MEK 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
MEK Inhibitor I		374.5	≥ 95% by HPLC (sum of two isomers)	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol (50 mg/ml)	444937-1MG	26,900
						444937-5MG	67,000
	細胞透過性のピリジン含有 vinylogous cyanamide 化合物。強力かつ選択的な MEK 阻害剤として作用し（IC_{50} = 12 nM）、MKK3 および MKK4 にはほとんど作用を示しません（IC_{50} > 1 μM）。阻害作用は Erk と競合せず、本化合物は ATP 結合型 MEK に対してのみ高い親和性を示します（ATP 非競合的阻害）。水溶液中で U0126（製品番号 662005）より優れた効力、溶解性、および安定性を示します。マウスにおいてフォルボールエステルによる耳浮腫に対する保護作用を示すことが明らかになっています（ED_{50} = 5 mg/kg、i.p.）。						
MEK Inhibitor II	623163-52-0	289.7	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	444938-5MG	22,900
[2-Chloro-3-(N-succinimidyl)-1,4-naphthoquinone]	MEK の強力かつ選択的な阻害剤として働く細胞膜透過性の 1、4- ナフトキノン化合物（MEK1 に対する IC_{50} = 0.38 μM）。PKC および PKA に対してはほとんど影響を示さず、Raf1 および Erk1 は非常に高濃度でのみ阻害します（それぞれ IC_{50} = 34.5 および 82.9 μM）。						
MEK1/2 Inhibitor	305350-87-2	335.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml) or Ethanol (10 mg/ml)	444939-1MG	23,900
						444939-5MG	80,000
[Z- & E-α-(Amino-((4-aminophenyl)thio)methylene)-2-(trifluoromethyl)benzeneacetonitrile; SL327]	MEK1/2 の選択的阻害剤として働く細胞膜透過性のビニル基含有シアナミド（それぞれ IC_{50} = 180 nM および 220 nM）。AP-1 を阻害する（IC_{50} = 2.03 μM）ほか、ERK1、MKK3/p38、MKK4、JNK および PKC の活性を非常に高い濃度（IC_{50} > 10 μM）で阻害することが示されています。マウスにおいて、ERK1/2 活性化を選択的に遮断することにより虚血性脳外傷に対する神経保護をもたらすことが報告されています。また、IL-1β の発現を抑制します。U0126（製品番号 662005）に比べて、高い水溶性を示します。						
MEK1/2 Inhibitor II	212631-61-3	476.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (45 mg/ml) or Ethanol (45 mg/ml)	444965-5MG	43,000
N-Cyclopropylmethoxy-3,4,5-trifluoro-2-(4-iodo-2-methylphenylamino)benzamide	経口投与可能なアミノベンズアミド化合物。いくつかの動物モデルにおいて抗骨関節炎作用および抗痛覚過敏症作用を示します。MEK1/2 の強力かつ可逆的な非 ATP 競合阻害剤として作用し（IC_{50} = 8 nM）、ERK、c-Src、Cdk's および PI 3-Kγ（IC_{50} >1.0 μM、> 4.0 μM、> 4.0 μM および > 10.0 μM）に対するより優れた選択性を示します。滑液線維芽細胞において MEK 活性を阻害し（IC_{50} 約 30-100 nM）、pERK1/2 および MMP-1 のアップレギュレートされたレベルを下げることが知られています。						
MEK1/2 Inhibitor III	391210-10-9	482.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml)	444966-5MG	35,000
N-((2R)-2,3-Dihyroxypropoxy)-3,4-difluoro-2-((2-fluoro-4-iodophenyl)amino)-benzamide	細胞透過性のベンズアミド化合物。非競合的できわめて強力かつ選択的な MEK/MAPKK/MKK 阻害剤として作用し、細胞の Erk1/2 リン酸化を効果的に阻止しますが（25 nM 阻害剤存在下の血清刺激後血清飢餓状態においた HeLa 細胞中では >90%、0.33 nM 阻害剤存在下の C26 細胞中では 50%）、無細胞キナーゼアッセイにおいては阻害剤濃度 10 μM でも Erk1/2 や他の 66 種類のキナーゼパネルの活性にほとんど、もしくは全く影響しません。マウスには経口投与が可能で、*in vivo* で BRAF（V600E）発現 SKMEL28 細胞由来腫瘍の増殖と腫瘍細胞中における Erk リン酸化をいずれも抑制することが報告されています。						

mTOR 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
mTOR Kinase Inhibitor II, WYE-354	1062169-56-5	495.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO	475986-5MG	36,900
mTOR Inhibitor III, PP242		344.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO	475988-5MG	24,900
mTOR Inhibitor IV, Ku-63794	938440-64-3	465.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO	475990-5MG	30,900

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Myosin Light Chain Kinase（MLCK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Gö 7874, Hydrochloride		507	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）	365252-500UG	28,900
	プロテインキナーゼ C の強力かつ選択的阻害剤（ラット脳 PKC について IC_{50} = 4 nM）。より高濃度においては、プロテインキナーゼ A（IC_{50} = 510 nM）、プロテインキナーゼ G（IC_{50} = 4.8 μM）およびミオシン L 鎖キナーゼ（IC_{50} = 120 nM）を阻害します。						
ML-7, Hydrochloride	110448-33-4	452.7	> 98% by TLC	+4℃	DMSO（4.5 mg/ml）or 50% ethanol（4.5 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffer just prior to use.	475880-1MG	27,900
[1-（5-Iodonaphthalene-1-sulfonyl）homopiperazine, HCl]	ミオシン L 鎖キナーゼの、細胞浸透性かつ選択性の強力な阻害剤（K_i= 300 nM）。より高濃度において、プロテインキナーゼ A（K_i= 21 μM）およびプロテインキナーゼ C（K_i= 42 μM）を阻害します。						
ML-9, Hydrochloride	105637-50-1	361.3	≥ 99% by TLC	+4℃	50% Ethanol（10 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffer just prior to use.	475882-1MG	27,900
[1-（5-Chloronaphthalene-1-sulfonyl）homopiperazine, HCl]	ミオシン L 鎖キナーゼ（K_i = 3.8 μM）、プロテインキナーゼ A（K_i = 32 μM）およびプロテインキナーゼ C（K_i= 54 μM）の細胞浸透性阻害剤。インタクト、および浸透可能としたクロマフィン細胞のカテコールアミン分泌も阻害します。						
Myosin Light Chain Kinase Inhibitor Peptide 18		1324.6	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	475981-5MG	43,000
（H-RKKYKYRRK-NH_2; MLCK Inhibitor Peptide 18）	塩基性の高いノナペプチド。選択的 MLCK 阻害剤として作用します（IC_{50} = 50 nM）。カルモジュリン（CaM）によるキナーゼ活性化には影響を与えず、CaMKII および PKA の活性も阻害しません。阻害作用はペプチド基質と競合し（K_i= 52 nM）、ATP と部分的に競合します。						
Piceatannol	10083-24-6	244.2	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（10 mg/ml）	527948-1MG	12,900
（*trans*-3,3′,4,5′-Tetrahydroxystilbene）	分離した酵素標本中で非受容体チロシンキナーゼ $p72^{syk}$（IC_{50}= 10 μM）の活性を Lyn よりも選択的に阻害する植物代謝物。RBL-2H3 細胞では piceatannol による Syk の選択的阻害により FceR1 を介したシグナリングが阻害されます。またラット肝臓 PKA 触媒サブユニット（IC_{50}=3 μM）、PKC（IC_{50} = 8 μM）、MLCK（IC_{50}=12 μM）およびコムギ胚 Ca^{2+} 依存性プロテインキナーゼ（CDPK）（IC_{50}=19 μM）も阻害します。また抗白血病性も示します。						
Staurosporine, N-Benzoyl	120685-11-2	570.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO	539648-1MG	45,000
Staurosporine, Streptomyces sp.	62996-74-1	466.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO or MeOH	569397-1MG 569397-100UG 569397-250UG	108,000 36,900 60,000
W-5, Hydrochloride	61714-25-8	342.9	> 98% by NMR	+4℃	DMSO or H_2O	681625-1MG	22,000
[N-（6-Aminohexyl）-1-naphthalenesulfonamide, HCl]	Ca^{2+} カルモジュリン依存性フォスフォジエステラーゼ（IC_{50} = 240 μM）およびミオシン軽鎖キナーゼ（IC_{50} = 230 μM）を阻害するカルモジュリンアンタゴニスト。						
W-7, Hydrochloride	61714-27-0	377.4	> 98% by TLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）, DMF, or warm Ethanol	681629-10MG	22,900
[N-（6-Aminohexyl）-5-chloro-1-naphthalenesulfonamide, HCl]	Ca^{2+} カルモジュリン依存性フォスフォジエステラーゼ（IC_{50} = 28 μM）およびミオシン軽鎖キナーゼ（IC_{50} = 51 μM）を阻害するカルモジュリンアンタゴニスト。						
W-12, Hydrochloride	89108-46-3	314.8	≥ 97% by TLC	-20℃	Ethanol（5 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	681635-1MG	22,000
[N-（4-Aminobutyl）-2-naphthalenesulfonamide, HCl]	Ca^{2+} カルモジュリン依存性フォスフォジエステラーゼ（IC_{50} = 260 μM）およびミオシン軽鎖キナーゼ（IC_{50} = 300 μM）を阻害するカルモジュリンアンタゴニスト。						
W-13, Hydrochloride	88519-57-7	349.3	≥ 98% by HPLC and single spot by TLC	+4℃	H_2O（35 mg/ml）	681636-1MG	22,000
[N-（4-Aminobutyl）-5-chloro-2-naphthalenesulfonamide, HCl]	Ca^{2+} カルモジュリン依存性フォスフォジエステラーゼ（IC_{50} = 68 μM）およびミオシン軽鎖キナーゼ（IC_{50} = 58 μM）を阻害するカルモジュリンアンタゴニスト。						

p21 Activated Kinase（PAK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
p21-Activated Kinase Inhibitor, PAK18		3413.9	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	506101-2MG	47,000
（PAK Inhibitor, PAK18; H_2N-RKKRRQRRR~G~PPVIAPRPEHTKSVYTRS-CO_2H）	PAK（p21 活性化キナーゼ）の阻害ペプチド。細胞透過性の TAT ペプチド配列と PIX-PAK 相互作用を妨害する PAK の Pro リッチな 18-mer PIX 相互作用モチーフから成り、細胞の PAK リン酸化を抑えて、神経変性した形態の海馬ニューロンを *in vitro* で誘導します。*in vivo* では PAK18 のマウス脳室内投与によってアルツハイマー様の疾患表現型がもたらされました。また、PIX 相互作用モチーフ配列は NIH-3T3 細胞において ras 依存的な腫瘍の成長と PAK の活性化を妨げることも示されています。活性のない対照用ペプチド（PAK18-R192A）も販売しております（製品番号 506102）。						
p21-Activated Kinase Inhibitor, Negative Control		3328.8	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	506102-2MG	62,000
（PAK18-R192A; H_2N-RKKRRQRRR~G~PPVIAPAPEHTKSVYTRS-CO_2H）	p21 活性化キナーゼの阻害剤である PAK18（製品番号 506101）に単一のアミノ酸変異（R192A）を導入したもの。活性のない対照用ペプチドとして働きます。						
p21-Activated Kinase Inhibitor III, IPA-3	42521-82-4	350.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（2 mg/ml）	506106-5MG 506106-25MG	21,900 66,900
2,2′-Dihydroxy-1,1′-dinaphthyldisulfide	細胞透過性の対称ジスルフィド化合物。グループ I PAK 自己調節ドメインを選択的に標的とし、PAK1 の非 ATP 競合的なアロステリック阻害剤として作用します（PAK1、PAK2/3 および 214 キナーゼパネル中の 9 キナーゼに対する IC_{50}= 2.5 μM、< 10 μM および < 10 μM）。PAK1 の活性化を阻害するが前活性化 PAK1 は阻害せず、マウス胚線維芽細胞において Erk の PDGF 誘導活性化を抑制することが知られています。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

PI 3- キナーゼ 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
ET-18-OCH3	70641-51-9	523.7	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) , $CHCl_3$ (50 mg/ml) , Ethanol (5 mg/ml) , or H_2O. Material may form micelles in aqueous stock solutions, which may affect experimental results.	341207-5MG	22,900
(Edelfosine; 1-O-Octadecyl-2-O-methyl-*rac*-glycero-3-phosphorylcholine)	腫瘍細胞およびウイルス形質転換細胞に対して選択的な殺細胞活性を示す細胞毒性物質です。本品は、ホスファチジルイノシトール特異的ホスホリパーゼ C (PI-PLC) を選択的に阻害し (IC_{50} = 15 μM)、ホスファチジルコリン特異的な PLC または PLD に対しては阻害作用を示しません。マイトジェン活性化 T 細胞において用量・時間依存的にアポトーシスを促進しますが、休止期 T 細胞においてはアポトーシス促進作用を示しません。また、ヒト白血病細胞において、急速かつ選択的にアポトーシスを促進します。						
LY 294002	154447-36-6	307.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (20 mg/ml) or Ethanol. Slight warming may be required to achieve complete solubilization.	440202-5MG 440202-10MG 440202-25MG	14,000 18,000 35,000
[2-(4-Morpholinyl)-8-phenyl-4H-1-benzopyran-4-one]	細胞浸透性の強力かつ特異的なフォスファチジルイノシトール 3- キナーゼ (PI 3 キナーゼ) の阻害剤 (IC_{50} = 1.4 μM)。酵素の ATP 結合座位に作用します。460 kDa フォスファチジルイノシトール 3- 様キナーゼである DNA-PK_{cs} の nonhomologous DNA end-joining (NHEJ) も阻害します。DNA-PK_{cs} は ,DNA 活性化プロテインキナーゼの酵素サブユニットです。50 μM でも EGF 受容体キナーゼ ,MAP キナーゼ、PKC、PI 4- キナーゼ、S6 キナーゼおよび c-Src の活性に影響しません。培養ウサギ大動脈平滑筋細胞に対し、アポトーシスを誘導することなく、増殖阻害を示します。						
LY 303511	154447-38-8	306.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	440203-1MG	27,900
(2-Piperazinyl-8-phenyl-4H-1-benzopyran-4-one)	PI 3 キナーゼ阻害剤である LY 294002 (製品番号 440202) のネガティブコントロールとして有用です。LY 294002 モルホリン環の 1 原子が置換された構造をもっています。濃度 100 μM でも PI 3- キナーゼを阻害しません。						
InSolution™ LY 294002	154447-36-6	307.4	≥ 98% by HPLC	-20℃		440204-1MG	11,900
[2-(4-Morpholinyl)-8-phenyl-4H-1-benzopyran-4-one]	DMSO に LY 294002 (製品番号 440202) の 10 mM (1 mg/325 μl) 溶液。						
LY 294002, 4′-NH2	942289-87-4	322.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (30 mg/ml)	440206-5MG	30,000
2-(4-Morpholinyl)-8-(4-aminophenyl)-4H-1-benzopyrone-4-one, PI-828	p110α/β/δ/γ (有効性 nM/- 倍の増加 IC_{50}= それぞれ 183/2.7-、98/5.7-、1227/.5-、1967/1.9-) に対して有効性の高められた細胞透過性の LY 294002 (Cat. Nos. 440202 & 440204) 4′- アミノ誘導体。分子は結合試験のために 4'- アミンを通じてエポキシ樹脂を含む固体表面に固定され、mTOR や ALDH1、Brd4、GSK3β、CKIIα などの非 PI3K 細胞タンパク質と相互作用することが示されています。						
Myricetin	529-44-2	318.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	476275-25MG	18,000
3, 3′,4′,5,5′,7-Hexahydroxyflavone	抗炎症作用、抗糖尿病作用および抗癌作用を示す細胞透過性のフラバノイド。非 ATP 競合的 MEK1 阻害剤として作用し (IC_{50} < 3 μM) ,CKI, CKII, IR, MLCK, PKA および PKC (Ki = 9.0 μM, 0.6 μM, 2.6 μM, 1.7 μM, 27.5 μM および 12.1 μM) ならびに PI 3-Kα および PIM-1 (IC_{50} = 1.8 μM および 0.78 μM) の ATP 競合的阻害剤として作用します。フォスフォジエステラーゼ 1-4 (IC_{50} < 40 μM) および MMP-2 (複数の結腸直腸癌細胞における IC_{50} < 24 μM) の活性を阻害し ,TNFα を介した NF-κB シグナル伝達 (ECV304 細胞において 50 μM で) およびインスリン刺激グルコース輸送 (ラット脂肪細胞における K_i= 約 33.5 μM) を抑制します。また、HL-60 白血病細胞において IC_{50} 43 μM でアポトーシスを誘導します。						
PIKfyve Inhibitor	371942-69-7	467.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml) . Enhanced solubility in DMSO can be achieved by the addition of a small drop of TFA.	524611-5MG	45,900
6-Amino-N-(3-(4-(4-morpholinyl) pyrido [3′2′:4,5]furo[3,2-d]pyrimidin-2-yl) phenyl-3-pyridine carboxamide	細胞透過性のピリドフロピリミジン化合物。PIKfyve の強力かつ選択的な可逆的阻害剤として作用し (PIKfyve、Fab1 および p110a に対する IC_{50} = 33 nM、> 5 μM および 3.3 μM)、800 nM で使用した場合に NIH3T3 細胞における PI-3、5-P_2 および PI-4、5-P_2 の産生を 80% および 20% 低下させます。腫脹した小胞および EGF 受容体の蓄積を引き起こします。						
PI-103	371935-74-9	348.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) . Slight warming may be required for complete solubilization.	528100-1MG 528100-5MG	25,900 52,300
[3-(4-(4-Morpholinyl) pyrido[3′,2′:4,5] furo[3,2-d]pyrimidin-2-yl) phenol]	ヒト神経膠腫のマウスモデルにおいて抗腫瘍特性を示す細胞透過性 pyridinylfuranopyrimidine 化合物。広範な脂質やタンパク質キナーゼに対する選択性を有する DNA-PK、PI 3-K、mTOR (DNA-PK、p110α、p110β、p110δ、p110γ、PI 3-KC2β、mTORC1、mTORC2 について IC_{50} (nM) = 2、8、88、48、150、26、20、83) の強力な ATP 競合阻害剤として作用します。PIP3 産生、インシュリンシグナル伝達、Akt リン酸化を阻害し、細胞増殖を抑制して、細胞死を誘導することが報告されています。						
InSolution™ PI-103		348.4	≥ 97% by HPLC	-20℃		528101-2MG	43,000
PI 3-Kγ Inhibitor	648450-29-7	257.3	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO (2.5 mg/ml)	528106-5MG	40,000
(5-Quinoxalin-6-ylmethylene-thiazolidine-2,4-dione)	細胞透過性のチアゾリジンジオン化合物。フォスファチジルイノシトール 3 キナーゼ γ (PI 3-Kγ) の強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します (K_i = 7.8 nM ; p110-γ、α、β および δ; アイソフォームについて、それぞれ IC_{50} = 8 nM、60 nM、270 nM、300 nM)。他の広範な一群のキナーゼ、受容体、酵素およびイオンチャンネルに対しては、1 μM の高濃度でも活性に影響を与えません。初代培養 Pik3cγ$^{+/+}$ マウス単球およびヒト単球細胞株 THP-1 において MCP-1 依存的な Akt リン酸化と化学走性を選択的に阻害しますが (IC_{50} = 181 nM)、CSF-1 依存的なリン酸化は阻害しません。また、マウス腹膜炎および関節炎モデルにおいて *in vivo* で好中性の化学走性を抑える効果があることが示されています。						
PI 3-Kγ Inhibitor II	648449-76-7	285.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	528108-5MG	39,000
[5-(2,2-Difluoro-benzo[1,3]dioxol-5-ylmethylene)-thiazolidine-2,4-dione]	細胞透過性のチアゾリジンジオン化合物。PI 3-Kγ の強力な ATP 競合阻害剤として作用し (K_i= 180 nM; IC_{50} = 250 nM)、p110-α (IC_{50} = 4.5 μM) および -β、-δ; アイソフォーム (IC_{50} > 20 μM) に対するより約 18 倍および 80 倍以上高い選択性を示します。様々なキナーゼ、受容体、酵素、およびイオンチャンネルに対しては、1 μM でほとんど阻害作用を示しません。マウス腹膜炎における好中球走化性を抑制し、BCR 刺激による B 細胞増殖をわずかに阻害することが明らかになっています。						
PI 3-Kα Inhibitor IV		386.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	528111-5MG	48,000
[3-(4-Morpholinothieno[3,2-d]pyrimidin-2-yl) phenol, HCl]	細胞透過性のモルホリノチエノピリミジン化合物。PI 3-K の強力なアイソフォーム選択的阻害剤として作用し (p110α、p110β、p110γ および PI 3-K C2β について、それぞれ IC_{50} = 2 nM、16 nM、660 nM および 220 nM)、PI 3-K 以外のキナーゼは非常に高濃度でのみ阻害します (Cdk2/E、KDR,PKA および PKCα に対する IC_{50} ≥ 3.4 μM)。A375 メラノーマ細胞において細胞の増殖 (IC_{50} = 580 nM) と血清の刺激による Akt のリン酸化 (IC_{50} < 3 μM) を阻害することが示されています。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

PI 3- キナーゼ 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
PI 3-Kγ/CKII Inhibitor		305.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（20 mg/ml）	528112-5MG	37,000
[(5-(4-Fluoro-2-hydroxyphenyl) furan-2-ylmethylene) thiazolidine-2,4-dione]	細胞透過性のフラニル - チアゾリジンジオン化合物。PI 3-Kγ および CKII の強力な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 20 nM）。非常に高濃度でのみ他の PI 3-K アイソタイプ（α、β、δ に対してそれぞれ IC_{50} = 0.94、20、20 μM）および MKK7β（IC_{50} > 10 μM）を阻害し、77 種類のよく研究されている他のキナーゼに対しては 10 μM の高濃度でもほとんど活性を示しません。*in vitro* 細胞における刺激による Akt リン酸化を阻害し、*in vivo* マウス腹膜炎モデルうにおけるチオグリコール酸誘導好中球動員を抑制することが示されています。						
PI 3-Kβ Inhibitor VI, TGX-221	663619-89-4	364.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	528113-1MG	64,000
[(±)-7-Methyl-2-(morpholin-4-yl)-9-(1-phenylaminoethyl)-pyrido[1,2-a]-pyrimidin-4-one]	細胞透過性のモルフォリノ - ピリミジノン化合物。PI 3-Kb の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し (-β、-δ、-α および -γ アイソフォームに対する IC_{50} = 5 nM、100 nM、5.0 μM および > 10.0 μM)、他の 15 キナーゼに対するより優れた選択性を示します（PI 3-KC2α、PI 4-K、Abl、EGFR、Fyn、HER2、IR、CKII、Cdk2/a、Erk1、p38α、p70S6K、PKA、PKC および CaMK に対する IC_{50} > 10.0 μM）。PI-3、4-P2 の産生を抑制し、刺激による血小板凝集を抑制することが知られています。また、ラットにおいて抗トロンビン作用を示します（2 mg/kg、*i.v.*）。						
PI 3-Kγ Inhibitor VII	6318-41-8	249.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（40 mg/ml）	528114-5MG	31,000
5-(Benzo[1,3]dioxol-5-ylmethylene)-thiazolidine-2,4-dione	細胞透過性のチアゾリジンジオン化合物。強力な ATP 競合的、アイソフォーム選択的 PI 3-K 阻害剤として作用し（γ、α、β、δ アイソフォームに対する IC_{50} = 0.07、0.24、1.45、1.70 μM)、38 種類の他の一般的なキナーゼのパネルに対してはほとんど作用を示しません（1.0 μM で <20% 阻害)。経口投与によって LY 294002（製品番号 440202 および 440204）に類似した薬物動態を示しますが、*in vitro* マウスにおける rhRNATES 誘導性の好中球腹腔内動員を 3 倍強力に抑制します（ED_{50} = 27.35 mg/kg、p.o.)。また、ラット足浮腫モデルにおいてカラゲナン誘発組織腫脹に対する優れた *in vivo* 予防作用を示すことが知られています（100 mg/kg、p.o.)。						
PI 3-Kα Inhibitor VIII		524.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	528116-5MG	48,900
[N-((1E)-(6-Bromoimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl) methylene)-N'-methyl-N''-(2-methyl-5-nitrobenzene) sulfonohydrazide, HCl]	細胞透過性のイミダゾピリジン化合物。強力な PI 3-Kα 選択的阻害剤として作用します（p110α、p110γ、PI 3-K C2β および p110β に対する IC_{50} = 0.3 nM、40 nM、100 nM および 850 nM)。MCF7 ADR-res を含むいくつかの腫瘍細胞の増殖を停止させ（IC_{50} = 19-58 nM)、子宮頸がん異種移植マウスモデル（50 mg/kg、i.p.）において抗腫瘍作用を示すことが知られています。						
PI 3-K inhibitor IX, PIK-90	677338-12-4	351.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（0.5 mg/ml）. Slight warming may be required to for complete solubility.	528117-5MG	24,000
N-(2,3-Dihydro-7,8-dimethoxyimidazo[1,2-c] quinazolin-5-yl)-3-pyridinecarboxamide	PI 4-KIIIβ ならびに ATR（IC_{50} = それぞれ 3.1 ならびに 15 μM）に対して有効性がかなり低く、PI 4-KIIα、PIPKs（IC_{50} >100 μM）と研究対象になることの多い 36 種類のタンパク質キナーゼ（<15% 阻害、10 μM 時）に対してはほとんど、あるいは全く活性のない一方、複数の PIKK（DNA-PK、ATM、mTORC1 に対して、IC_{50} = それぞれ 13、610、1050 nM）ならびに PI 4-KIIIα（IC_{50} = 830 nM）と同様に、PI 3-K キナーゼ（p110α、p110γ、PI 3-KC2α、p110δ、PI 3-KC2β、p110β、hsVPS34 に対して、IC_{50} = それぞれ 11、18、47、58、64、350、830 nM）の 3 つのすべてのクラスに対して、有効で可逆的、ATP 競合的な阻害剤として働く細胞透過性の imidazoquinazoline 化合物。3T3-L1 含脂肪細胞や L6 筋管における Akt ならびに rpS6 インスリン刺激のリン酸化反応を用量依存的に *in vitro*（ >90%、2.5 μM 時）で効果的に抑制し、マウス *in vivo*（10 mg/ml、腹腔内投与）のインスリン誘発性血糖の低下を完全に防ぎます。						
PI 3-Kδ Inhibitor X, IC87114	371242-69-2		≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	528118-5MG	17,900
	NB-4 および初代培養 APL 細胞で PI 3-Kδ を選択的に阻害する細胞透過性化合物（ p110β、p110δ および p110γ の IC_{50} = それぞれ 1.82、0.07 および 1.24 であり、100 Â μM の高濃度では p110a も標的になりますが、低力価)。初代培養 AML 細胞の PI 3K/Akt シグナリングの構造的活性化は、主として PI 3-Kδ によることが報告されています。PI 3-Kδ 阻害剤の薬理学的使用によって、PI 3K/Akt/mTOR シグナリングが阻止されることが示されており、これによって増殖が抑制され、アポトーシスが誘導されると考えられます。関連する試験からも、アレルギー性疾患またはマスト細胞関連疾患において、PI 3-Kδ は PI 3-K アイソフォームのなかでも重要な治療標的であることが示されています。						
PI 3-K Inhibitor XI, HWT		430.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml）; Use only fresh DMSO.	528119-5MG	40,000
	ウォルトマニン(IC_{50} = それぞれ 0.5 ならびに 4.2 nM)と比較して 8.4 倍高い有効性をもつ不可逆 PI 3-K 阻害剤として働き、ずっと高い濃度(IC_{50} = 0.193 μM）のときにのみ mTOR を阻害する細胞透過性ウォルトマニン（製品番号 681675、681676）17β- ヒドロキシ類似体（HWT)。ウォルトマニンと HWT の両者は、C-20 の位置のときに求電子フラン環を通じて PI 3-K ATP 結合ポケットの保存リジン残基 (Lys833 in porcine PI 3-Kγ) を共有結合的に修飾します。HWT は、LNCaP 細胞（IC_{50} = 1.464 μM）*in vitro* の成長を効果的に停止させることを示していますが、その高い *in vivo* 毒性によりマウスの殺腫瘍研究には不適切となります。また、ヒト好中球の fMLP（製品番号 05-22-2500）刺激において後期 PLD 介在 PA 生成を阻害すると報告されています。						
PI 3-K/PDK-1 Inhibitor, NVP-BAG956	853910-02-8	427.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	528121-5MG	37,000
PTK/PI 3-K/mTOR Inhibitor, PP121	1092788-83-4	319.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO	529584-5MG	20,000
Quercetin, Dihydrate	6151-25-3	338.3	> 98% by HPLC	room temp.	Acetic Acid（1 mg/ml）, Aqueous Alkali（1 mg/ml）, or DMSO（5 mg/ml）	551600-100MG	10,900
(3,3',4',5,7-Pentahydroxyflavone)	PI 3- キナーゼ（IC_{50} = 3.8 μM）およびフォスフォリパーゼ A_2（IC_{50} = 2 μM）の阻害剤。ミトコンドリア ATPase、フォスフォジエステラーゼおよびプロテインキナーゼ C も阻害します。K562、Molt-4、Raji および MCAS 腫瘍細胞株のアポトーシスを誘発します。						
Wortmannin	19545-26-7	428.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（25 mg/ml）or Methanol（5 mg/ml）	681675-1MG	7,000
(KY 12420)	細胞浸透性の真菌代謝産物。フォスファチジルイノシトール 3 キナーゼ（PI 3 キナーゼ）の精製調製品および細胞質画分に対し、選択的、不可逆的、かつ強力な細胞浸透性阻害剤として作用します（IC_{50} = 5 nM)。上流のシグナル現象に影響することなく、PI 3 キナーゼの触媒活性を妨げます。ワートマニンと共に繊維芽細胞をプレインキュベートすると、PDGF 媒介性の Ins（3、4、5）P3 形成が消失します（IC_{50} = 5 nM)。また、単離したラット脂肪細胞において、インスリン受容体チロシンキナーゼ活性に影響することなく、インスリンの代謝作用をブロックします。モルモット好中球において、血小板活性化因子によって誘導される MAP キナーゼの活性化を阻害します（200-300 nM)。また、PI 3 キナーゼの阻害に要求されるものより約 100 倍高い濃度では、ミオシン L 鎖キナーゼ（IC_{50} = 200 nM）や PI 4 キナーゼなどの他のキナーゼも阻害します。また、フォスフォリパーゼ D もブロックします。MW=428.4.						
InSolution™ Wortmannin		428.4	≥ 95% by HPLC	-20℃		681676-1MG	20,000
	Wortmannin（製品番号 681675）の 10 mM（1 mg/233 μL）DMSO 溶液。真菌代謝物。精製物およびサイトゾル画分においてフォスファチジルイノシトール 3- キナーゼ（PI 3-K）の強力かつ選択的な細胞透過性の可逆的阻害剤として作用します（IC_{50} = 5 nM)。線維芽細胞をワートマニンとともにプレインキュベーションすると PDGF を介した Ins（3、4、5）P3 形成が阻害されます（IC_{50} = 5 nM)。上流のシグナル伝達には影響を与えずに PI 3-K の触媒活性を抑制します。また、インスリン受容体チロシンキナーゼ活性には影響を与えずに単離ラット脂肪細胞におけるインスリンの代謝作用を抑制します。モルモット好中球において血小板活性化因子によって誘導された MAPK 活性化を阻害します（0.2-0.3 μM)。破骨細胞性骨吸収を阻害します。PI 3-K の阻害に必要な濃度の 100 倍の濃度でミオシン軽鎖キナーゼ（IC_{50} = 200 nM）や PI 4-K などの他のキナーゼを阻害します。また、フォスフォリパーゼ D を阻害します。						

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Kinase A（PKA）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Protein Kinase A Inhibitor 5-24	99534-03-9	2222.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）. Sonication or the addition of a few drops of dilute acid（10 mM HCl）may be necessary to achieve complete solubilization.	116805-500UG	34,000
（H-TTYADFIASGRTGRRNAIHD; Protein Kinase A Inhibitor 5-24）	強力な PKA の合成ペプチド阻害物質（K_i= 2.3 nM）。本品の配列は PKA の熱安定性骨格筋阻害タンパク質に由来しています。PKA の触媒サブユニットに結合し、調節サブユニットと置換します。アルギニンクラスター塩基性基質を介して触媒座位と結合することにより、タンパク質基質と類似した挙動を示します。						
cAMPS, Rp-Isomer, TEA Salt	151837-09-1	446.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O（20 mg/ml）	116814-5UMOL	50,900
（Adenosine 3',5'-cyclic Phosphorothioate-Rp; Rp-cAMPS, TEA）	PKA の細胞膜透過性阻害剤（K_i= 11 µM）。フォスフォジエステラーゼによる加水分解に対する抵抗性を示します。						
cAMPS, 8-Bromo-, Rp-Isomer, Sodium Salt		446.1	≥ 99% by HPLC	-20℃	H_2O（40 mg/ml）	116816-5UMOL	98,000
（Rp-8-Br-cAMPS, Na）	強力かつ代謝的に安定な細胞膜透過性 cAMP アンダゴニスト。cAMP 依存性プロテインキナーゼ（PKA）を阻害し、I 型 PKA に対する選択性を示します。cAMP 拮抗剤 Rp-cAMPS（製品番号 116814）より高い親油性を有します。						
Adenosine 3', 5'-cyclic Monophosphorothioate, 8-Chloro-, Rp-Isomer, Sodium Salt	142754-27-6	401.7	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	116819-5UMOL	122,000
（Rp-8-Cl-cAMPS, Na）	PKA の競合的阻害剤として作用する、代謝的に安定な細胞膜透過性 cAMP アナログ。cAMP 拮抗剤 cAMPS（製品番号 116814）の親油性アナログです。I 型 PKA を選択的に阻害します（IC_{50} = 約 50 µM）。						
Adenosine 3', 5'-cyclic Monophosphorothioate, 2'-O-Monobytyryl	152218-23-0	437.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	116825-5UMOL	122,000
（Rp-MB-cAMPS, Na）	代謝的に安定な、Rp-cAMPS（製品番号 116814）の細胞膜透過性前駆体。I 型・II 型 PKA の競合的阻害剤として作用します。エステラーゼによる代謝活性化中には、阻害剤と酪酸塩が放出されます。Rp-cAMPS よりはるかに高い親油性および細胞膜透過性を有します。						
H-8, Dihydrochloride	113276-94-1	338.3	＞ 95% by TLC	+4℃	H_2O（10 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffer just prior to use.	371958-1MG 371958-5MG	23,000 85,000
{N-[2-（Methylamino）ethyl]-5-isoquinolinesulfonamide, 2HCl}	環状ヌクレオチド依存性プロテインキナーゼの強力な細胞透過性阻害剤です。プロテインキナーゼ A、ミオシン L 鎖キナーゼ、プロテインキナーゼ C およびプロテインキナーゼ G に対し、K_i=1.2 µM、68 µM、15 µM、480 nM で阻害します。						
KT5720	108068-98-0	537.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（1 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffers just prior to use.	420320-50UG 420320-100UG	22,900 37,900
	化学修飾した K-252a。プロテインキナーゼ A の強力で特異的かつ細胞浸透性の阻害剤です（K_i= 56 nM）。PKC、PKG あるいは MLCK の活性に対しては顕著な影響を示しません。神経細胞の培養において軸索の分枝を阻害します。						
InSolution™ KT5720	108068-98-0	537.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	420323-50UG	22,900
	KT5720（製品番号 420320）の 2mM DMSO 溶液（50 µg/47 µl）。						
Protein Kinase A Inhibitor 14-22 Amide, Cell-Permeable, Myristoylated		1209.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	476485-500UG	20,900
（Myr-GRTGRRNAI-NH_2; Myristoylated Protein Kinase A Inhibitor Amide 14-22, Cell-Permeable; Protein Kinase A Inhibitor 14-22 Amide; PKI 14-22 Amide, Cell-Permeable）	N 末端のミリストイル化により細胞浸透性が増加した熱安定性プロテインキナーゼ阻害物質（PKI）ペプチド配列（14-22）。本ペプチドの非ミリストイル化型は cAMP 依存性プロテインキナーゼ（PKA）の高度に特異的な阻害物質です（K_i= 36 nM）。						
Protein Kinase A Inhibitor 6-22 Amide	121932-06-7	1868.1	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	539684-1MG	29,900
（Protein Kinase A Inhibitor 6-22 Amide; PKI 6-22 Amide, PKA Inhibitor; TYADFIASGRTGRRNAI-NH_2）	PKA の強力な競合的阻害物質（K_i= 1.7 nM）。						
InSolution ™ Staurosporine, Streptomyces sp.	62996-74-1	466.5	≥ 97% by HPLC	-70℃		569396-100UG	37,900
TX-1123		312.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	655200-10MG	26,000
[2-（（3,5-di-*tert*-Butyl-4-hydroxyphenyl）-methylene）-4-cyclopentene-1,3-dione]	アリリデン - シクロペンテンジオンに由来する、細胞透過性のチルフォスチン。Src（IC_{50} = 2.2 µM）、eEF2-K（IC_{50} = 3.2 µM）、および PKA（IC_{50} = 9.6 µM）の阻害剤として作用します。極めて高濃度で EGFR-K および PKC を阻害します（IC_{50} = 320 µM）。別のチルフォスチン AG 17（製品番号 658425）と比較して、強力な抗腫瘍作用を示し［EC_{50} = 3.66 µM（HepG2 腫瘍細胞）、39 µM（HCT116 腫瘍細胞）］、ミトコンドリア毒性（≥ 1/1、000）および肝毒性（≥ 1/50）が大幅に低下しています。したがって、本品はより有望ながん治療薬の候補物質です。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Kinase C (PKC) 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Protein Kinase C Inhibitor Peptide 19-31 RFARKGALRQKNV		1543.8	≥ 97% by HPLC	-20℃	5% acetic acid (1 mg/ml)	05-23-4904-1MG	27,000
	PKC 阻害剤 19-36（製品番号 539560）よりも有効、可逆的、基質競合的な PKC（IC_{50} = 100 nM）の阻害剤。自己リン酸化反応とタンパク質基質リン酸化反応との両方を阻害します。						
Bisindolylmaleimide I {2-[1-(3-Dimethylaminopropyl)-1H-indol-3-yl]-3-(1H-indol-3-yl)-maleimide; Gö 6850; GF 109203X}	133052-90-1	412.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml). Further dilute with aqueous buffers just prior to use.	203290-250UG 203290-1MG	8,000 22,000
	選択性の高い細胞膜透過性プロテインキナーゼ C（PKC）阻害剤（K_i= 10 nM）。構造的にスタウロスポリンに類似しています。PKC の ATP 結合部位に対する競合的阻害剤として作用します。PKC アイソザイム α、$β_I$、$β_{II}$、γ、δ、および ε に高い選択性を示します。高濃度ではプロテインキナーゼ A に対する阻害作用も示します（K_i= 2 μM）。また、ケルセチン、H-89、またはハービマイシン A で処理した NPC-076 細胞におけるテロメラーゼ活性も阻害します。						
Bisindolylmaleimide I, Hydrochloride {2-[1-(3-Dimethylaminopropyl)-1H-indol-3-yl]-3-(1H-indol-3-yl) maleimide, HCl}	176504-36-2	448.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml) or H_2O (10 mg/ml)	203291-250UG 203291-1MG	10,900 39,000
	Bisindolylmaleimide I（製品番号 203290）の水溶性を向上させたもの。プロテインキナーゼ C を阻害します（K_i= 10 nM）。さらに高濃度においては、プロテインキナーゼ A に対する阻害作用も示します（K_i= 2 μM）。						
Bisindolylmaleimide II {2-[1-[2-(1-Methylpyrrolidino)ethyl]-1H-indol-3-yl]-3-(1H-indol-3-yl) maleimide}		438.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	203292-1MG	37,000
	強力かつ選択的なプロテインキナーゼ C 阻害剤（IC_{50} = 13 nM）。さらに高濃度においては、プロテインキナーゼ A に対する阻害作用も示します（IC_{50} = 2 μM）。						
InSolution™ Bisindolylmaleimide I {2-[1-(3-Dimethylaminopropyl)-1H-indol-3-yl]-3-(1H-indol-3-yl)-maleimide; Gö 6850}	133052-90-1	412.5	≥ 95% by HPLC	-20℃		203293-1ML	30,000
	Bisindolylmaleimide I（製品番号 203290）の 1 mg/ml 無水 DMSO 溶液です。						
Bisindolylmaleimide IV [Arcyriarubin A; 2,3-*bis*(1H-Indol-3-yl) maleimide]	119139-23-0	327.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	203297-1MG	32,000
	強力かつ選択的なプロテインキナーゼ C 阻害剤（IC_{50} = 87 nM）。さらに高濃度においては、プロテインキナーゼ A に対する阻害作用も示します（IC_{50} = 2.7 μM）。						
Bisindolylmaleimide V [2,3-*bis*(1H-Indol-3-yl)-N-methylmaleimide; Ro 31-6045]	113963-68-1	341.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	203303-250UG 203303-1MG	13,900 32,900
	プロテインキナーゼ C 阻害試験におけるネガティブコントロールとして有用です（IC_{50} > 100 μM）。						
Calphostin C, *Cladosporium cladosporioides* (UCN-1028c)	121263-19-2	790.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (1 mg/ml) or Ethanol	208725-50UG 208725-100UG	10,900 18,000
	プロテインキナーゼ C に対する特異性の高い阻害剤（IC_{50} = 50 nM）。ジアシルグリセロールエステルおよびホルボールエステルに対する結合部位で競合することによって、タンパク質の調節ドメインと相互作用します。Ca^{2+} またはリン脂質とは競合しません。高濃度においては、ミオシン軽鎖キナーゼ（IC_{50} > 5 μM）、プロテインキナーゼ A（IC_{50} > 50 μM）、プロテインキナーゼ G（IC_{50} > 25 μM）、および $p60^{v\text{-}src}$（IC_{50} > 50 μM）を阻害します。また、HL-60 ヒト前骨髄性白血病細胞において、アポトーシス性の DNA 断片化および細胞死を誘導します。活性化には光を必要とします。						
Chelerythrine Chloride	3895-92-9	383.8	≥ 97% by NMR	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml). Heating to 40-50℃ with gentle agitation may be necessary to achieve complete solubilization. Further dilute with buffer just prior to use.	220285-5MG	23,900
	天然に存在するアルカロイド。プロテインキナーゼ C に対する強力かつ選択的な細胞膜透過性阻害剤です（IC_{50} = 660 nM）。PKC の触媒ドメインに作用します。リン酸受容体に対しては競合的な阻害作用を示し、ATP に対しては非競合的な阻害作用を示します血小板におけるトロンボキサン生成およびフォスフォイノシチド代謝を阻害します。また、HL-60 ヒト前骨髄性白血球細胞において、アポトーシス性の DNA 断片化および細胞死を誘導します。						
D-erythro-Sphingosine, N,N-Dimethyl-	119567-63-4	327.6	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml), Ethanol, or Methanol	310500-5MG	23,000
	プロテインキナーゼ C（IC_{50} = 12 μM）を阻害し、Src キナーゼ活性を刺激します。白血球または腫瘍細胞が血小板および内皮細胞へ接着するのを促進するセレクチンの細胞表面発現を阻害する際に有用です。ヒト白血病 HL-60 細胞においてアポトーシスを誘導します。スフィンゴシンキナーゼ阻害剤。						
Gö 6976 [12-(2-Cyanoethyl)-6,7,12,13-tetrahydro-13-methyl-5-oxo-5H-indolo(2,3-a) pyrrolo(3,4-c)-carbazole; Go 6976]	136194-77-9	378.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	365250-500UG 365250-1MG	23,000 52,900
	Protein kinase C（PKC）の阻害剤です（ラット脳について IC_{50} = 7.9 nM）。Ca^{2+} 依存性 PKC α- アイソザイム（IC_{50} = 2.3 nM）および $PKC_{βI}$（IC_{50} = 6.2 nM）を選択的に阻害します。Ca^{2+} 非依存性 PKCδ-、ε- および ζ- アイソザイムのキナーゼ活性には、μM レベルでも影響しません。高濃度において、$PKC_μ$ を阻害することが報告されています（IC_{50} = 20 nM）。HIV-1 誘導の強力な阻害剤です。						
Gö 6983 {2-[1-(3-Dimethylaminopropyl)-5-methoxyindol-3-yl]-3-(1H-indol-3-yl) maleimide; Go 6983}	133053-19-7	442.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	365251-500UG	23,900
	数種類のプロテインキナーゼ C（PKC）アイソザイムを阻害する強力な PKC 阻害剤です（$PKC_α$ および $PCK_β$ について IC_{50} = 7 nM; $PKC_γ$ について 6 nM; $PKC_δ$ について 10 nM; $PKC_ζ$ について 60 nM）。$PKC_μ$ を有効に阻害しないので（IC_{50} = 20 μM）、$PKC_μ$ と他の PKC アイソザイムとの識別に使用できます。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Kinase C (PKC) 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
InSolution™ Gö 6976	136194-77-9	378.4	≥ 95% by HPLC	-20℃		365253-1ML	37,000
[12-(2-Cyanoethyl)-6,7,12,13-tetrahydro-13-methyl-5-oxo-5H-indolo(2,3-a)pyrrolo(3,4-c)-carbazole; Go 6976, Solution]	DMSO に Gö 6976（製品番号 365250）の 500 µg/ml 溶液。						
H-7, Dihydrochloride	108930-17-2	364.3	≥ 98% by TLC	+4℃	H_2O（20 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffers just prior to use.	371955-1MG	23,000
[1-(5-Isoquinolinesulfonyl)-2-methylpiperazine, 2HCl]	広範囲な細胞透過性セリン / スレオニンキナーゼ阻害剤です。プロテインキナーゼ A、ミオシン L 鎖キナーゼ、プロテインキナーゼ C およびプロテインキナーゼ G に対し、K_i=3.0 µM、97 µM、6.0 µM 、5.8 µM で阻害します。↓ HL-60 ヒト前骨髄球性白血病細胞でのアポトーシスによる DNA 断片化および細胞死を誘導します。またケルセチン、H-89 あるいは herbimycin A 処理を行った NPC-076 細胞でのテロメラーゼ活性を阻害します。						
HBDDE	154675-18-0	338.3	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）, Ethanol（1 mg/ml）, or warm H_2O（1 mg/ml）	372770-1MG	37,000
(2,2′,3,3′,4,4′-Hexahydroxy-1,1′-biphenyl-6,6′-dimethanol Dimethyl Ether)	細胞浸透性プロテインキナーゼ C（PKC）阻害剤。*in vitro* 試験では、PKCα、βI および βII アイソザイムよりも PKCα（IC_{50} = 43 µM）および PKCγ（IC_{50} = 50 µM）を選択的に阻害します。齧歯類小脳顆粒ニューロンのアポトーシスを誘導することが報告されています。						
Hispidin	555-55-5	246.2	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	377980-2MG	37,000
[6-(3,4-Dihydroxystyrl)-4-hydroxy-2-pyrone]	プロテインキナーゼ Cβ アイソフォーム（PKCβ）の強力な阻害剤（IC_{50} = 2 µM）。*in vitro* で正常細胞よりもがん細胞に対して強力な細胞毒性作用を示します。						
K-252c		311.3	> 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）or Methanol	420305-1MG	37,000
	プロテインキナーゼ A（IC_{50} = 25.7 µM）およびプロテインキナーゼ C（IC_{50} = 2.45 µM）を阻害します。						
Melittin	37231-28-0	2846.5	>97% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	444605-250UG	17,000
	Ca^{2+} 依存的にカルモジュリンと結合する、ハチ毒素由来の 26 残基ポリペプチド。シナプス膜においてアデニル酸シクラーゼ活性を阻害することが報告されている、$G_i\alpha$ および $G_{11}\alpha$ 活性の刺激因子です。フォスフォリパーゼ A_2 を活性化し、また Mg^{2+}-ATP 感受的に触媒ドメインに結合することにより、プロテインキナーゼ C を阻害します（IC_{50} = 5-7 µM）。いくつかの Ca^{2+} 結合タンパク質のアフィニティ精製にも使用されています。						
Protein Kinase C Inhibitor, EGF-R Fragment 651-658, Myristoylated		1308.7	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O（5 mg/ml）	476475-500UG	28,000
[Myr-N-RKRTLRRL-OH; Myristoylated EGF-R Fragment (651-658), Protein Kinase C Inhibitor; Protein Kinase C Inhibitor, EGF-R Fragment 651-658, Myristoylated]	v-ErbB（95-102）と同一の配列が維持されている上皮増殖因子受容体（EGF-R）。N 末端がミリストイル化された膜浸透性プロテインキナーゼ C 阻害物質（IC_{50} = 5 µM）です。						
Protein Kinase C Inhibitor 20-28, Cell-Permeable, Myristoylated		1255.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	Tris-HCl, pH 7.5 (25 mg/ml) or H_2O（10 mg/ml）	476480-500UG	27,900
(Myr-N-FARKGALRQ-NH_2; Myristoylated Protein Kinase C Inhibitor 20-28, Cell-Permeable; Protein Kinase C 20-28, Cell-Permeable, Myristoylated)	プロテインキナーゼ C_α（PKC_α）および PKC β に由来する偽基質。N 末端をミリストイル化して膜浸透を可能にしています。繊維芽細胞一次培養における MARCKS リン酸化の TPA 活性化の高特異性阻害物質です（IC_{50} = 8 µM）。100 µM で 98% の阻害を示します。						
Phloretin	60-82-2	274.3	≥ 98% by TLC	-20℃	Acetone, ethanol, or methanol	524488-200MG	23,000
(2′,4′,6′-Trihydroxy-3-*p*-hydroxyphenylpropiophenone)	プロテインキナーゼ C を阻害します。両生類有髄神経線維の Ca^{2+} 活性化 K^+ チャネルを µM レベルの濃度で活性化します。筋 - イノシトール取り込みを阻害します。また L 型 Ca^{2+} チャネルの活性を阻害します。5'- ヨードチロニン脱ヨウ素酵素を強力に阻害します。星状膠細胞のフォスフォリパーゼ -C と連関しているプロスタグランジン $F_{2\alpha}$ 受容体の拮抗物質です。						
Polymyxin B Sulfate	1405-20-5			room temp.	H_2O（25 mg/ml）	5291-500MG 5291-1GM 5291-5GM	8,500 15,500 54,000
(Aerosporin)	リン脂質感受性 Ca^{2+} 依存性プロテインキナーゼを阻害する抗生物質。硫酸ポリミキシン B_1 およびポリミキシン B_2 の混合物です。						
Protein Kinase Cε Translocation Inhibitor Peptide		844	≥ 97% by HPLC	+4℃	H_2O（3 mg/ml）	539522-5MG	29,000
(EAVSLKPT; Protein Kinase C_ε Translocation Inhibitor Peptide; PKC_ε Translocation Inhibitor Peptide)	PKC_ε の細胞周縁部への移動を阻害する 8 アミノ酸ペプチド。PKC_ε の移動の阻害により、フォルボールエステルあるいはノルエピネフィリンを介した心筋細胞収縮の調節が遮断されることが知られています。						
Protein Kinase Cε Translocation Inhibitor Peptide, Negative Control		844	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	539542-5MG	41,000
(LSETKPAV; Protein Kinase C_ε Translocation Inhibitor Peptide, Negative Control)	Protein Kinase C_ε Translocation Inhibitor Peptide（製品番号 539522）と同じアミノ酸組成を有するスクランブル化ペプチド。PKC_ε Translocation Inhibitor のネガティブコントロールとして有用です。						
Protein Kinase C Inhibitor Peptide 19-36		2151.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O（0.1%）	539560-500UG 539560-1MG	36,000 62,000
(Protein Kinase C Inhibitor Peptide 19-36; RFARKGALRQKNVHEVKN)	プロテインキナーゼの活性座位に結合する偽基質。プロテインキナーゼ C を強力に阻害しますが（K_i= 147 nM）、プロテインキナーゼ A は阻害しません（IC_{50} = 423 µM）。						
Protein Kinase Cη Pseudosubstrate Inhibitor, Myristoylated		2373.9	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	539604-500UG	44,000
(Myr-TRKRQRAMRRRVHQING-NH_2; Protein Kinase C_η Pseudosubstrate Inhibitor, Myristoylated)	プロテインキナーゼ C_η アイソザイムの細胞浸透性阻害物質。						
Protein Kinase Cζ Pseudosubstrate Inhibitor		1718	≥ 95% by HPLC	-20℃	Glacial acetic acid（2 mg/ml）or H_2O（2 mg/ml）	539610-500UG	34,900
(Protein Kinase $C_{\zeta 4}$ Pseudosubstrate Inhibitor; SIYRRGARRWRKL)	プロテインキナーゼ C_ζ アイソザイムの選択的阻害物質。						
Protein Kinase Cζ Pseudosubstrate Inhibitor, Myristoylated		1928.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O（2 mg/ml）	539624-500UG	25,000
(Myr-SIYRRGARRWRKL-OH; Protein Kinase C_ζ Pseudosubstrate Inhibitor, Myristoylated)	プロテインキナーゼ C_ζ アイソザイムの細胞浸透性阻害物質。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Kinase C (PKC) 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Protein Kinase C_θ Pseudosubstrate Inhibitor, Myristoylated		2318.9	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (2 mg/ml)	539636-500UG	45,900
(Myr-LHQRRGAIKQAKVHHVKC-NH_2; Protein Kinase C_θ Pseudosubstrate Inhibitor, Myristoylated)	プロテインキナーゼ C_θ アイソザイムの細胞浸透性阻害物質。						
PKC θ/δ Inhibitor			≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or Ethanol (1 mg/ml)	539649-5MG	27,900
5-(3,4-Dimethoxyphenyl)-4-(1H-indol-5-ylamino)-3-pyridinecarbonitrile	他の PKC (δ、ε、η イソ型に対して IC_{50} = それぞれ 0.35、2.33、16.35 μM) に対しては有効性がずっと低く、従来の PKCβ ならびに非典型 PKCζ (IC_{50} >50 μM) に対しては、一般的な研究対象となっている 18 種類の細胞キナーゼのパネル (IC_{50} >10 μM) と同様に、ほとんどあるいは全く活性のない、有効で ATP 競合的 (K_i = 79 nM、結合 PK/LDH アッセイにおける PKCθ KD 使用) アイソザイム選択的 PKCθ 阻害剤 (IC_{50} = 70 nM) として働く細胞透過性ピリジンカルボニトリル化合物。PKCθ ノックアウトマウス (IC_{50} = それぞれ 58 ならびに 231 nM) の野生型由来の抗 CD3 ならびに抗 CD28 活性化 T 細胞からの IL-2 生成を選択的に阻害することが示されています。						
$PKC_{βII}$/EGFR Inhibitor	145915-60-2	365.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml)	539652-2MG	33,000
[4,5-bis(4-Fluoroanilino)-phthalimide; CG53353; CGP 53 353; DAPH 2]	細胞透過性の対称フタルイミド化合物。EGFR (IC_{50} = 0.7 μM)、PKC アイソザイム α (IC_{50} = 1.9 μM)、βI (IC_{50} = 3.8 μM)、および βII (IC_{50} = 0.41 μM) に対する強力な ATP 競合阻害剤として作用し、新しい非定型 PK アイソザイムを含む他の 16 種類のキナーゼに対してはほとんど作用を示しません。*in vitro* でインスリン刺激による 2- デオキシグルコースの細胞内取り込み、破骨細胞分化、ERK 活性化、および TLS/FUS DNA 結合活性を阻害し、*in vivo* でマウスにおいて抗腫瘍作用を示すことが知られています。						
$PKC_β$ Inhibitor	257879-35-9	411.5	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	539654-500UG	35,900
[3-(1-(3-Imidazol-1-ylpropyl)-1H-indol-3-yl)-4-anilino-1H-pyrrole-2,5-dione]	アニリノ -monoindolylmaleimide 化合物。PKCβ アイソザイムの強力な ATP 競合阻害剤として作用します [IC_{50} = 5 nM (ヒト PKCβII)、21 nM (βI)]。PKCβ に対して PKCα (IC_{50} = 331 nM)、PKCγ (IC_{50} > 1000 nM)、および PKCε (IC_{50} = 2807 nM) より高い選択性を示します。						
Rottlerin	82-08-6	516.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (30 mg/ml) or Ethanol (1 mg/ml)	557370-10MG	17,000
(Mallotoxin)	$PKC_δ$ (IC_{50} = 3-6 μM) および PKC θ に対し高い選択性を示す PKC 阻害剤。$PKC_α$、$PKC_β$ および $PKC_γ$ アイソフォームも阻害しますが、効力はかなり低下します (IC_{50} = 30-42 μM)。また、$PKC_ε$、$PKC_η$ および $PKC_ζ$ に対しても低い阻害活性を有し (IC_{50} = 80-100 μM)、CaM キナーゼ III も阻害することが知られています (IC_{50} = 5.3 μM)。						
Ro-31-7549	125313-65-7	458.5	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	557508-1MG	26,000
{2-[1-3(Aminopropyl) indol-3-yl]-3(1-methyl-1H-indol-3-yl) maleimide, Acetate; Bisindolylmaleimide VIII, Acetate}	PKC の ATP 結合部位に作用する選択的プロテインキナーゼ C (PKC) 阻害剤 (ラット脳 PKC については IC_{50} = 158 nM)。フォスフォリパーゼ $C_{γ1}$ の活性化またはチロシンリン酸化は阻害しません。PKC アイソザイム特異性をある程度示します ($PKC_α$ については IC_{50} = 53 nM、$PKC_{βI}$ については 195 nM、$PKC_{βII}$ については 163 nM、$PKC_γ$ については 213 nM、$PKC_ε$ については 175 nM)。カルバコールが引き起こすノルアドレナリン放出も阻害します (IC_{50} = 600 nM)。						
Ro-31-8425	131848-97-0	461	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	557514-1MG	17,000
{2-[8-(Aminomethyl)-6,7,8,9-tetrahydropyrido[1,2-a]indol-3-yl]-3-(1-methyl-1H-indol-3-yl) maleimide, HCl; Bisindolylmaleimide X, HCl}	強力かつ選択的なプロテインキナーゼ C 阻害剤 (ラット脳 PKC に対する IC_{50} = 15 nM)。アイソザイム特異性をある程度示します ($PKC_α$ については IC_{50} = 8 nM、$PKC_{βI}$ については 8 nM、$PKC_{βII}$ については 14 nM、$PKC_γ$ については 13 nM、$PKC_ε$ については 39 nM)。						
InSolution™ Ro-31-8220		553.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	A 5 mM (500 μg/181 μl) solution of Ro-31-8220 (Cat. No. 557520) in H_2O.	557521-500UG	20,900
{3-[1-[3-(Amidinothio) propyl-1H-indol-3-yl]-3-(1-methyl-1H-indol-3-yl) maleimide; Bisindolylmaleimide IX, Methanesulfonate}	CaM キナーゼ II (IC_{50} = 17 μM) ならびにタンパク質キナーゼ A (IC_{50} = 900 nM)。初代脂肪細胞 (IC_{50} = 6.8 nM) や GSK-3b 免疫沈降物 (IC_{50} = 2.8 nM) の GSK-3 を有効に阻害します。MAP キナーゼホスフォターゼ -1 の発現や JNK1 の活性剤の阻害剤。HL-60 細胞の PKC への効果に関わらず、Raf-1 のリン酸化を阻害しアポトーシスを誘発します。						
Ro-32-0432		489	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	557525-1MG	34,900
{3-(8-((dimethylamino) methyl)-6,7,8,9-tetrahydropyrido[1,2-*a*]indol-10-yl)-4-(1-methyl-1*H*-indol-3-yl)-1*H*-pyrrole-2,5-dione hydrochloride; Bisindolylmaleimide XI, HCl; 2-{8-[(Dimethylamino) methyl]-6,7,8,9-tetrahydropyrido[1,2-a]indol-3-yl}-3-(1-methyl-1H-indol-3-yl) maleimide, HCl}	選択的な細胞浸透性プロテインキナーゼ C 阻害剤。$PKC_ε$ (IC_{50} = 108 nM) に比べ、$PKC_{βI}$ (IC_{50} = 28 nM) に対しては 4 倍、$PKC_α$ (IC_{50} = 9 nM) に対しては 10 倍高い選択性を示します。また、*in vivo* で T 細胞による慢性炎症反応を防ぎます。						
Safingol	15639-50-6	301.5	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml), ethanol (10 mg/ml), or methanol (5 mg/ml)	559300-1MG	34,000
(L-*threo*-Dihydrosphingosine)	PKC のホルボール結合調節ドメインと競合的に相互作用するリン - スフィンゴ脂質プロテインキナーゼ C (PKC) 阻害剤。精製ラット脳 PKC の酵素活性および ^{3}H- ホルボール二酪酸の結合を阻害します (それぞれ、IC_{50} = 37.5 μM および 31 μM)。MCF-7 DOXR 細胞で過剰発現される主要なアイソザイムのヒト $PKC_α$ を阻害します (IC_{50} = 40 μM)。胃がん細胞において、薬剤誘発性アポトーシスを促進することにより、化学療法薬 Mitomycin C (MMC; 製品番号 47589 および 475820) の細胞傷害効果を強化します。						
Sangivamycin	18417-89-5	309.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	0.1 M KOH (5 mg/ml)	559307-1MG	21,000
(7-Deaza-7-carbamoyladenosine; NSC-65346)	ヒトサイトメガロウイルス (HCMV) に対して活性な細胞毒性プリンヌクレオシド。強力かつ選択的なプロテインキナーゼ C (PKC) 阻害剤です (IC_{50} = 10 μM)。この阻害は ATP に関して競合的ですが、ヒストン、脂質コファクターについては競合しません。						
D-erythro-Sphingosine, Free Base, High Purity	123-78-4	299.5	≥ 98% by TLC	-20℃	Methanol (1 mg/ml), Chloroform (1 mg/ml), or DMSO (10 mg/ml)	567726-10MG	23,000
(*trans*-D-*erythro*-2-Amino-4-octadecene-1,3-diol; Ceramide; Cerebroside)	プロテインキナーゼ C (PKC; IC_{50} = 2.8 μM) およびインシュリン受容体チロシンキナーゼの強力かつ選択的な阻害剤。PKC の阻害はジアシルグリセロール、ホルボール二酪酸および Ca^{2+} に関して競合的です。ミオシン軽鎖キナーゼ、プロテインキナーゼ A の活性には影響しません。ヒト白血病 HL-60 細胞においてアポトーシスを誘導します。						
Tamoxifen Citrate	54965-24-1	563.7	≥ 99% by HPLC	+4℃	Ethanol (5 mg/ml)、Methanol (5 mg/ml)、or sparingly soluble in H_2O	579000-100MG	10,000
	強力な合成抗エストロゲン剤。可逆的なプロテインキナーゼ C 阻害剤 (IC_{50} = 10 μM)。ヒト悪性神経膠腫細胞株でアポトーシスを誘導し、p21 タンパク質の誘導により、前立腺癌の細胞増殖を阻害します。						
Tamoxifen, 4-Hydroxy-, (Z)-	68047-06-3	387.5	≥ 98% by TLC	+4℃	Ethanol (20 mg/ml, heating may be required) or Methanol (10 mg/ml)	579002-5MG	25,000
[(Z)-4-Hydroxytamoxifen; 4-OH-TAM]	広く使用されている治療用抗エストロゲン剤、Tamoxifen (製品番号 579000) の活性代謝産物で、より強力です。触媒ドメインを修飾することにより、プロテインキナーゼ C を阻害します。						

Protein Kinase G (PKG) 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Drosophila Antennapedia Homeo-Domain（43-58） （DT-5; RQIKIWFQNRRMKWKK）		2246.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	287895-1MG	24,000
ショウジョウバエのアンテナペディアホメオドメイン（43 - 58）に由来する膜通過シグナル配列。PKG Iα の阻害剤として作用することが報告されています（K_i= 970 nM）。プロテインキナーゼ A（PKA）に対しては著しい阻害作用を示しません（K_i= 107 μM）。高荷電ペプチドを共有結合により細胞内に輸送するにも有用です。							
PknG Inhibitor 2-（Cyclopropanecarbonylamino-4,5,6,7-tetrahydro-1-benzothiophene-3-carboxamide,	329221-38-7	264.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	370653-10MG	23,000
細胞透過性のテトラヒドロベンゾチオフェン化合物。マイコバクテリアのプロテインキナーゼ G（PknG）に対するきわめて特異的な ATP 結合部位を標的とする阻害剤として作用しますが（IC_{50} = 390 nM）、PknG 以外のマイコバクテリア由来キナーゼ 8 種類および、PknG に類似の哺乳動物キナーゼ PKCa を含むヒト由来キナーゼ 25 種類に対する阻害活性はほとんどありません。マクロファージ内の M. bovis BCG（ウシ型結核菌：結核予防用の BCG ワクチンとして利用される抗酸菌）のリソソーム輸送と分解の PknG による阻止能を、感染宿主外 BCG の増殖には影響を及ぼさない濃度（10 μM 以上）で完全に失活させます。							
Protein Kinase G Inhibitor （Protein Kinase G Inhibitor; RKRARKE）		943.1	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	370654-1MG	18,000
PKA（K_i= 550 μM）より特異性の高い PKG（K_i= 86 μM）阻害物質。本品の配列はヒストン H2B（29-35 番残基）のリン酸化不可能類似体（Ser^{32} を Ala^{32} に置換）に対応します。							
Protein Kinase G Iα Inhibitor, Cell-Permeable （DT-3; cGMP-dependent Protein Kinase Iα Inhibitor, Cell Permeable; cGPK Iα Inhibitor, Cell Permeable; Protein Kinase G Iα Inhibitor; RQIKIWFQNRRMKWKKLRKKKKKH）		3294.1	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	370655-1MG	27,900
PKG Iα を選択的に阻害する（K_i= 25 nM）、膜透過性の非常に強力なショウジョウバエのアンテナペディアホメオドメイン融合ペプチドです。動脈平滑筋細胞に効率よく移行し、NO 誘導性の血管拡張を阻害することが明らかになっています（ED_{50} = 47 μM）。極めて高濃度では PKA も阻害します（K_i= 493 μM）。							
8-Bromo-cGMPS, Rp-Isomer, Sodium Salt （Rp-8-Br-cGMPS, Na）		462.2	≥ 99% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	370674-5UMOL	116,000
cGMP- 依存性プロテインキナーゼ（PKG）の強力な細胞浸透性かつ代謝安定的阻害剤（K_i= 4 μM）。サイクリックヌクレオチドゲーティングチャネルアゴニスト（EC_{50} = 173.5 μM）。cGMP あるいは Rp-cGMPS を大きく上回る親油性および細胞浸透性を示します。哺乳類サイクリックヌクレオチド依存性フォスフォジエステラーゼに抵抗性を示します。							
8-（4-Chlorophenylthio）-cGMPS, Rp-Isomer, TEA Salt （Rp-8-*p*CPT-cGMPS, TEA）		605.1	≥ 99% by HPLC	-20℃	DMSO or H_2O（0.5 mg/ml）	370677-1UMOL	59,900
cGMP 依存性プロテインキナーゼ（PKG）Iα、Iβ および II 型の細胞浸透性かつ代謝的に安定な強力な阻害剤。Rp-cGMP あるいは Rp-8-Br-cGMP（製品番号 370674）を大きく上回る親油性および膜浸透性を示します。							
Guanosine 3′,5′-cyclic Monophosphorothioate, β-Phenyl-1, N2-etheno-8-bromo-, RpIsomer, Sodium Salt （Rp-8-Br-PET-cGMPS, Na）	172806-20-1	562.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O（5 mg/ml）	370679-1UMOL	26,000
代謝的に安定な、プロテインキナーゼ G 1α および 1β の競合的阻害剤です（K_i= 30 nM）。また、レチナール型 cGMP 依存性イオンチャネルを阻害し（IC_{50} = 25 μM）、精製 II 型 PKA の活性化を抑制します（K_i= 10 μM）。Rp-8-pCPT-cGMPS（製品番号 370677）より高い脂溶性および細胞透過性を示します。							
HA 1077, Dihydrochloride [Fasudil;（5-Isoquinolinesulfonyl）homopiperazine, 2HCl]	103745-39-7	364.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	H_2O（1 mg/ml）	371970-1MG	22,900
血管攣縮抑制作用を有する細胞透過性 Ca^{2+} アンタゴニスト。プロテインキナーゼ A（IC_{50} = 1.6 μM）、プロテインキナーゼ G（IC_{50} = 1.6 μM）、およびミオシン軽鎖キナーゼ（IC_{50} = 36 μM）を阻害します。また、Rho 関連キナーゼ（ROCK）を強力に阻害することも知られています（IC_{50} = 10.7 μM）。							
KT5823	126643-37-6	495.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMF or DMSO（1 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffers just prior to use.	420321-50UG 420321-100UG	23,900 37,900
プロテインキナーゼ G に対する特異性の高い細胞浸透性阻害物質（K_i= 234 nM）。							

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
A77 1726 [N-(4-Trifluoromethylphenyl)-2-cyano-3-hydroxycrotoamide]	108605-62-5	270.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（35 mg/ml）	100128-5MG	27,000
生理活性を有する免疫抑制剤レフルノミド代謝物。増殖抑制特性および抗炎症特性を示します。ジヒドロオロト酸デヒドロゲナーゼ（DHO-DH）の活性を阻害します（IC_{50} = 220 nM）。L929 繊維芽細胞において iNOS の IFN-γ 誘導性発現を低下させることが報告されています。TNF を介した NF-κB 活性化を用量・時間依存的に抑制します。A549 細胞における $COX-2$ および PGE_2 合成の IL-1β 誘導性活性化を阻害します（IC_{50} =130 nM）。また、JAK1 および JAK3 の IL-2 誘導性チロシンリン酸化も阻害します。						
AG 825 [4-Hydroxy-3-methoxy-5-(benzothiazolylthiomethyl) benzylidenecyanoacetamide]		397.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	121765-2MG	25,900
HER2 自己リン酸化（*neu*/ErbB2; IC_{50} = 0.35 μM）を HER1（IC_{50} = 19 μM）より強力に阻害する選択的阻害剤。この阻害は、ATP 結合と競合します。$p185^{neu}$ を高レベルで発現する非小細胞肺がん（NSCLC）細胞株における化学感受性を増強します。							
AG 1024 (3-Bromo-5-*t*-butyl-4-hydroxy-benzylidenemalonitrile)		305.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	121767-1MG	19,900
インスリン様成長因子 -1（IGF-1）およびインスリン受容体チロシンキナーゼ活性の特異的阻害剤。インスリン受容体より IGF-1 に対して低い IC_{50} 値を示します。また、インスリン刺激による細胞増殖も阻害します。							
Angiogenesis Inhibitor [(*Z*,*E*)-3-(Imidazol-4-ylmethylene) indolin-2-one]		211.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	175580-10MG	24,000
細胞透過性のインドリノン化合物で血管新生阻害活性を示す（10 μM で *in vitro* rat aortic ring model で 30% 阻害）。SU5416 に匹敵（製品番号 676487; 10 μM で 22% 阻害）。 hEGF-R tyrosine kinase に対し中程度の ATP- 競合的阻害（54% inhibition at 10 μM）を示す。							
Bcr-abl Inhibitor [GNF-2; (3-(6)-(4-Trifluoromethoxy-phenylamino) -pyrimidin-4-yl)-benzamide]	778270-11-4	374.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（2 mg/ml）	197221-5MG	38,900
細胞透過性のピリミジン化合物。C-abl ミリストイル結合ポケットに結合し、細胞 Bcr-abl 活性ならびに Bcr-abl 依存的な細胞機能に対するアロステリックな非 ATP 競合阻害剤として作用します。63 種類のキナーゼパネルに対して 10 μM の高濃度でもほとんど抑制効果を示しません。また、無細胞 *in vitro* キナーゼアッセイにおいて、c-abl または Bcr-cbl を阻害しません。Bcr-abl を発現している細胞に対して強力かつ選択的な増殖抑制作用を示します（Ba/F3.p210、Ba/F3.p185Y253H、SUP-B15、Ba/F3.p210E255V および K562 において、それぞれ IC_{50} = 138 nM、194 nM、268 nM および 273 nM）							
Bcr-abl Inhibitor II 5-[(4-fluorobenzoyl) amino]-2-[(4-fluorobenzyl) thio]-1,3,4-thiadiazole	607702-99-8	363.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	197223-5MG	32,000
細胞透過性のチアジアゾール化合物。Abl および c-Src キナーゼの ATP 結合部位ターゲティング阻害剤として作用します（それぞれ K_i= 44 nM、354 nM）。イマチニブ /STI571 に対する耐性に関わらず、細胞内 Bcr-Abl Tyr^{245} リン酸化および Bcr-Abl 形質転換 32D 細胞のクローン原性を強力に阻害します。							
Bcr-abl Inhibitor III, GNF-5 N-(2-Hydroxyethyl)-3-(6-(4-(trifluoromethoxy) phenylamino) pyrimidin-4-yl) benzamide		418.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	197224-10MG	29,000
白血病のマウス異種移植モデルにおいて、Bcr ／ abl 発現 Ba/F3（93% and 83% of no-treatment control、respectively、on days 5 and 7 post treatment; 100 mg/kg b.i.d.）と骨髄細胞（~75% of no-treatment control in both WBC counts and spleen weight on day 7 post treatment; 50 mg/kg b.i.d.）の増殖の抑制に *in vivo* 効力を示す細胞透過性の GNF-2（製品番号 197221）N - ヒドロキシエチルカルボキサミド類似体。GNF-2 と同様に、GNF-5 は Abl キナーゼ領域の C 末端近くのミリスチン塩酸結合ポケットを標的にし、その結果 ATP 結合ポケットの構造動力に警告することによってアロステリック機構（IC_{50} = 0.22 μM against wild-type Abl）を通じてその効果を働かせます。GNF-5 はミリスチン塩酸結合部位の変異体 E505K ならびに ATP 結合部位のゲートキーパー変異体 T3151 に対しては無効です。							
Bruton's Tyrosine Kinase Inhibitor III 0N-Acryloyl-(3-(4-Amino-3-(4-phenyloxyphenyl) -1H-pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-1-yl) piperidine	936563-87-0	440.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）. Fresh DMSO is recommended.	203661-1MG	34,000
ピロロピリジニル - アクリロイル化合物。細胞透過性。Bruton チロシンキナーゼ（BTK）の非常に強力な不可逆的阻害剤として作用し（IC_{50} = 720 pM）、Lyn、Lck、Itk（IC_{50} = 14 nM、97 nM、1.0 μM）より高い選択性を示します。BTK-Cys481 残基を修飾し、PLC-g1 リン酸化および Ca^{2+} フラックスを抑制します（抗 IGM 刺激 Ramos 細胞における IC_{50} = 14 nM および 40 nM）。マウスモデルにおいて誘導関節炎を抑制し（3 mg/kg、p.o.）、抗炎症作用を示すことが知られています。							
BPIQ-I {8-[(3-Bromophenyl) amino]-3-methyl-3H-imidazo[4,5-g]-quinazoline}	174709-30-9	354.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	203696-1MG	27,000
表皮成長因子受容体（EGFR）のチロシンキナーゼ活性を強力かつ特異的に阻害します（IC_{50} = 25 pM）。							
BPDQ {4-[(3-Bromophenyl)amino]-6,7-diaminoquinazoline}		330.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	203697-1MG	27,000
表皮成長因子受容体（EGFR）のチロシンキナーゼ活性を強力かつ特異的に阻害します（IC_{50} = 120 pM）。							
Butein (2',4',3,4-Tetrahydroxychalcone)	487-52-5	272.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）or Methanol	203987-5MG	37,000
特異的タンパク質チロシンキナーゼ阻害剤として作用する植物ポリフェノール。EGF受容体（IC_{50} = 65 μM）および $p60^{c\text{-}src}$（IC_{50} = 65 μM）のチロシンキナーゼ活性を強力に阻害します。この阻害は、ATP に対しては競合的な作用であり、基質に対しては非競合的です。ブテインは、強力な抗酸化・抗炎症剤でもあります。グルタチオンリダクターゼおよびラット肝グルタチオン -S- トランスフェラーゼを阻害することが示されています（IC_{50} = 9 μM）。							
CL-387,785 {N-[4-[(3-Bromophenyl)amino]-6-quinazolinyl]-2-butynamide; EKI-785}		381.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	233100-1MG	27,000
in vitro における EGF 受容体（EGFR）キナーゼ活性（IC_{50} = 250-490 nM）、ならびに *in vivo* における EGFR 中のチロシン残基の EGF 刺激による自己リン酸化（IC_{50} = 5 nM）を不可逆的に阻害します。A431 細胞において、EGF を介した増殖を抑制します。EGFR に共有結合することによって、EGFR または c-ErbB2 を発現している細胞の増殖を阻害します（IC_{50} = 31-125 nM）。							
PD 153035 {AG 1517; 4-[(3-Bromophenyl)amino]-6,7-dimethoxyquinazoline; Compound 32; SU 5271}		360.2	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	234490-1MG	24,900
上皮細胞成長因子受容体（EGFR）のチロシンキナーゼ活性を極めて強力かつ特異的に阻害します（IC_{50} = 25 pM; K_i= 6 pM）。低い nM レベルで、繊維芽細胞またはヒト類表皮がん細胞における EGFR の自己リン酸化を迅速に抑制します。また、有糸分裂誘発、初期遺伝子発現、腫瘍化転換などの EGF が媒介するプロセスを選択的にブロックします。							
InSolution™ PD 153035		360.2	≥ 97% by HPLC	+4℃		234491-500UG	24,000
DMSO に PD 153035（製品番号 234490）の 10 mM（500 μg/139 μl）溶液。							

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Compound 56 {4-[(3-Bromophenyl)amino]-6,7-diethoxyquinazoline}	171745-13-4	388.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	234505-500UG	27,000
表皮成長因子受容体のチロシンキナーゼ活性に対して最も強力かつ特異的な阻害作用を示す化合物です（IC_{50} = 6 pM）。							
Cucurbitacin I, *Cucumis sativus L.* （JSI-124）	117793	514.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）or Ethanol（10 mg/ml）	238590-1MG	41,000
in vitro および *in vivo* の両方で抗増殖性および抗腫瘍性を示す細胞透過性のトリテルペノイド化合物（NCI 識別子：NSC 521777）。JAK/STAT3（Janus kinase/signal transducer and activator of transcription 3）シグナル経路の強力かつ非常に選択的な阻害剤。v-Src で形質転換した NIH 3T3 細胞およびヒト肺臓腺がん A549 細胞（IC_{50} = 500 nM）において、STAT3 チロシンリン酸化を抑制し、STAT3 DNA 結合および STAT3 媒介遺伝子転写の阻害をもたらします。ヌードマウスにおいて STAT3 形質転換腫瘍の増殖を阻害することが示されています。Ras、Akt、Erk1/2 または JNK によって媒介される発がん経路には影響を及ぼしません。							
Damnacanthal （3-Hydroxy-1-methoxyanthraquinone-2-aldehyde）	477-84-9	282.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	251650-1MG	26,000
$p56^{lck}$ チロシンキナーゼに対する強力かつ選択的な可逆的阻害剤です。$p56^{lck}$ の自己リン酸化（IC_{50} = 17 nM）および $p56^{lck}$ による外因性ペプチドのリン酸化（IC_{50} = 620 nM）を阻害します。$p56^{lck}$ に対して、PKA および PKC より 100 倍以上高い選択性を示し、EGF 受容体キナーゼ、c-ErbB2、インスリン受容体キナーゼ、および PDGF 受容体キナーゼより 40 倍高い選択性を示し、$p60^{src}$ および $p59^{fyn}$ より 7-20 倍高い選択性を示します。$p56^{lck}$ の阻害は、スルフヒドリル試薬の存在によって顕著な影響を受けません。また、抗マラリア作用を有し、ras 形質転換細胞の表現型を回復させることも知られています。							
5'-Deoxy-5'-methylthioadenosine （MeSAdo; MTA）	2457-80-9	297.3	≥ 99% by HPLC	-20℃	DMSO or DMF（25 mg/ml）	260585-50MG	21,000
天然に存在するポリアミン生合成の副産物。メチルチオアデノシンフォスフォリラーゼ（MTAP）の内在性基質として機能します。白血病 U937 細胞において、タンパク質カルボキシメチルトランスフェラーゼを強力に阻害し、アポトーシスを誘導します。FGF-2 受容体チロシンキナーゼに対しても阻害作用を示します。また、*in vitro* において、S49 細胞由来の高親和性 cAMP フォスフォジエステラーゼを阻害します（K_i= 62 μM）。							
DMBI {(Z)-3-[4-(Dimethylamino)benzylidenyl]indolin-2-one; SU 4312}	1429018	264.3	≥ 95% by HPLC (sum of two isomers)	-20℃	DMSO（50 mg/ml）	317200-10MG	18,000
PDGF β 受容体（β- PDGFR; IC_{50} = 4 μM in PAC-1 cells）および FGFR1（IC_{50} = 5 μM for inhibition of tyrosine phosphorylation of p90）のチロシンキナーゼ活性を強力に阻害します。EGFR または c-Src のチロシンキナーゼ活性に対しては、100 μM 以上でも阻害作用を示しません。							
EGFR/ErbB-2 Inhibitor [4557W; 4-(4-Benzyloxyanilino-6,7-dimethoxyquinazoline]	179248-61-4	387.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）or Methanol（1 mg/ml）	324673-1MG	23,000
EGFR および c-erbB2 の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として働く細胞透過性の 4- アニリノキナゾリン化合物（それぞれ IC_{50} = 20 nM および 79 nM）。これらは I 型成長因子受容体ファミリーのメンバーであり、乳がんの発生と進行に関わっています）。EGRF または c-erbB2 を過剰発現している腫瘍細胞の増殖を効果的に阻害することが示されています（IC_{50} = 約 1.2-2.5 μM）。							
EGFR Inhibitor [Cyclopropanecarboxylic acid-(3-(6-(3-trifluoromethyl-phenylamino)-pyrimidin-4-ylamino)-phenyl)-amide]	879127-07-8	413.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）or Ethanol（25 mg/ml）	324674-1MG	25,900
細胞透過性の 4, 6- ジアニリノピリミジン化合物。EGFR および一部の EGFR 変異体の強力かつ非常に選択的な ATP 競合阻害剤として作用し（EGFRwt、EGFRL858R および EGFRL861Q に対して、それぞれ IC_{50} = 21 nM、63 nM および 4 nM）、erbB4/Her4（IC_{50} = 7.64 μM）や他の 55 種類のキナーゼのパネルに対しては効果を示しません。10 μM で U-2OS 細胞における EGF 誘導性 EGFR 自己リン酸化を完全に阻害することが示されています。							
Emodin （6-Methyl-1,3,8-trihydroxyanthraquinone）	518-82-1	270.2	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（1 mg/ml）, Ethanol or Aqueous alkali	324694-50MG	19,900
強力な $p56^{lck}$ チロシンキナーゼ阻害剤（IC_{50} = 18.5 μM）。*v-ras*形質転換ヒト気管支上皮細胞の増殖を選択的に抑制します（IC_{50} = 15 μM）。また、HER2/neu を過剰発現している乳がん細胞における HER2/neu チロシンキナーゼ活性も抑制します。							
ErbB2 Inhibitor II		262.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	324732-5MG	32,900
細胞透過性トリアゾール化合物。MDA-MB-468 細胞で erbB1 よりも erbB2 のホスホリル化を選択的に抑制し（MDA-MB-453 細胞で IC_{50} = 6.6 μM）、抗増殖特性を示します。（MDA-MB-453 細胞で IC_{50} = 30.9 μM）。							
EGFR Inhibitor II, BIBX 1382 [BIBX1382BS; N^8-(3-Chloro-4-fluorophenyl)-N^2-(1-methylpiperidin-4-yl)-pyrimido[5,4-d]pyrimidine-2,8-diamine, 2HCl]	196612-93-8	496.8	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	324832-5MG	50,900
細胞透過性のピリミドピリミジン化合物。EGFR（ErbB-1、HER-1）に対し、無細胞酵素反応（IC_{50} = 3 nM）および培養中（KB 細胞における EGF、HGF および FCS 依存的なチミジン取り込みに対して、それぞれ IC_{50} = 0.15、1.82 および 3.2 μM）において強力かつ非常に選択的な可逆性 ATP 競合阻害剤として作用します。ErbB-2 に対するよりも 1,000 倍高い選択性を示し（HER-2、neu；IC_{50} = 3.4 μM）、IGF1R、β-InsRK、HGFR、c-src および VEGFR-2 に対しては 10 μM の高濃度でもほとんど活性を示しません。また、抗腫瘍効果が *in vivo* マウス異種移植片モデルにおいて示されています（毎日 10 mg/kg の経口投与）。							
EGFR Inhibitor III [N-(4-((3,4-Dichloro-6-fluorophenyl)amino)-quinazolin-6-yl)-2-chloroacetamide]		399.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（25 mg/ml）. Use fresh, anhydrous DMSO.	324833-5MG	43,000
細胞透過性のキナゾリニル - クロロアセトアミド化合物。EGFR 自己リン酸化を選択的かつ不可逆的に阻害し、EGFR の発現レベルには影響を与えません。平滑筋腫および子宮筋層細胞の増殖を抑制します（それぞれ IC_{50} = 0.7 μM および 1.1 μM）。アポトーシスおよび細胞周期停止を誘導し、Genistein（製品番号 345834）とともに平滑筋腫細胞の増殖を完全に抑制することが知られています。							
EGFR/ErbB-2/ErbB-4 Inhibitor [N-(4-((3-Chloro-4-fluorophenyl)amino)pyrido[3,4-d]pyrimidin-6-yl)-2-butynamide]	881001-19-0	400.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（4 mg/ml）. Use fresh DMSO only.	324840-1MG	34,900
細胞透過性のアルキンアミドピリミジン化合物。ATP 結合部位を標的として、erbB 活性の強力かつ不可逆的な阻害剤として作用します（erbB-1、erbB-2 および erbB-4 に対して、それぞれ IC_{50} = 0.3、1.1 および 0.5 nM）。NIH3T3-erbB-1 および MDA-MB-453 細胞において、EGF およびヘレグリンが誘導する erbB の自己リン酸化を阻害します（それぞれ、IC_{50} = 2.5 および 24 nM）。							
EGF/FGF/PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor PD-089828	1135256-66-4	405.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（1 mg/ml）	324841-2MG	28,000
InsR、PKC あるいは CDK4/Cyclin D1（IC_{50} >50 μM）に対してほとんど活性を示しませんが、ヒト FGFR-1、PDGFR-β、c-Src そして EGFR（IC_{50} = それぞれ 0.15、0.18、1.76、そして 5.47 μM）を阻害する細胞透過性で可逆的なタンパク質チロシンキナーゼ阻害剤です。この阻害剤は FGFR-1、PDGFR-β、EGFR の場合には ATP 競合を示しますが、c-Src の場合には非競合性を示します。							
EGFR/ErbB-2/ErbB-4 Inhibitor II	944341-54-2	519.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	324842-5MG	20,000
Focal Adhesion Kinase Inhibitor I 1,2,4,5-Benzenetetraamine	4506-66-5	284	≥95% by elemental analysis	+4℃	H_2O（14 mg/ml）or DMSO（50 mg/ml）	324877-5MG	14,900
細胞透過性のテトラアミン化合物。Fak Y397 相互作用に基づくコンピュータを用いた分子ドッキングスクリーニングにより同定され、無細胞キナーゼ活性測定（IC_{50} <1 μM）と乳癌由来の BT474 培養のいずれにおいても FAK（製品番号 324876）の自己リン酸化とともにパキシリンをリン酸化するキナーゼ活性を阻害する一方、Pyk2（製品番号 662067）の自己リン酸化あるいは c-Raf、c-Src、EGFR、VEGFR-3、IGF-1、Met、PDGFR-α、Pyk2、および PI 3-K のキナーゼ活性（p110δ/p85α）に対してはほとんど阻害活性を示さないことが判明しています。*in vitro* 培養中（IC_{50} は約 10 μM）および *in vivo* マウス体内（投与第 23 日における阻害率は無処理コントロールの約 25%；30 mg/kg を週 5 回腹腔内投与）のいずれにおいても BT474 増殖を阻害するとの報告があります。							

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
FGF/VEGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor, PD173074	219580-11-7	523.7	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	341607-5MG	25,900
[1-*t*-Butyl-3-(6-(3,5-dimethoxyphenyl)-2-(4-diethylaminobutylamino)-pyrido[2,3-d] pyrimidin-7-yl) urea; PD173074]	細胞透過性のピリドピリミジン化合物。FGF および VEGF 受容体に対して、強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用します（FGFR1 に対する IC_{50} = 21.5 nM）。非常に高い濃度でのみ PDGFR および c-Src を阻害し（それぞれ、IC_{50} = 17.6 μM、19.8 μM）、EGFR、InsR、MEK および cPKC に対しては 50 μM の高濃度でもほとんど影響を示しません。NIH3T3 細胞において *in vitro* で内在性の FGFR1（IC_{50} < 5 nM）と過剰発現された VEGFR2（IC_{50} < 200 nM）の自己リン酸化を阻害し、マウス *in vivo* で FGF および VEGF 誘導性の血管新生を阻害することが示されています。						
FGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor	192705-79-6	396.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	341608-5MG	45,900
1-(2-Amino-6-(3,5-dimethoxyphenyl) pyrido[2,3-d]pyrimidin-7-yl)-3-tert-butyl urea	細胞透過性のピリドピリミジニル尿素化合物。FGFR-1 の強力な可逆的かつ ATP 競合的な阻害剤として作用し（IC_{50} = 60 nM）、PDGFRb、EGFR、インスリン受容体および c-Src（IC_{50} > 50 μM）に対するよりはるかに高い選択性を示します。						
FGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor IV, NP603	949164-80-1	446.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	341609-5MG	39,000
3-(5-(6-(3,5-Dimethoxyphenyl)-2-oxo-1,2-dihydro-indol-3-ylidenemethyl)-2,4-dimethyl-1H-pyrrol-3-yl)-propionic acid	PDGFR Tyrosine Kinase Inhibitor VI、SU6668（製品番号 521235）の細胞透過性の 6-(3, 5- ジメトキシフェニル）アナログ。FGF-R1 の可逆的な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 400 nM）。FGF-2 誘導性の HUVEC 増殖（IC_{50} = 18.2 μM）および管様形成ならびに ERK および JNK の活性化を阻害することが知られています。						
FGF/PDGF/VEGF RTK Inhibitor	144335-37-5	277.3	95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	341610-5MG	30,000
4-Hydroxy-3-benzimidazol-2-ylhydroquinolin-2-one	細胞透過性のベンズイミダゾロヒドロキノリノン化合物。線維芽細胞増殖因子受容体 -1（FGFR-1）、血小板由来増殖因子受容体 β（PDGFRβ）および血管内皮増殖因子受容体 -2（VEGFR-2）の強力かつ ATP 競合的な可逆的阻害剤として作用します（IC_{50} はそれぞれ 90、20 および 240 nM）。血管内皮増殖因子（VEGF）により誘発されるヒト皮膚微小血管内皮細胞（HMVEC）の増殖を停止することが判明しています（EC_{50} = 420 nM）。						
Flt-3 Inhibitor	301305-73-7	360.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（<t;4 mg/ml）	343020-5MG	40,900
	細胞透過性のチエニルカルボキサミド化合物。Flt-3 の強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用し（IC_{50} = 42 nM）、抗増殖性を示します。他の 22 種類のキナーゼに対してはわずかな影響しか与えません（IC_{50} ≥ 3 μM）。MV4-11（活性型 Flt3 変異体を構成的に発現するヒト急性骨髄性白血病細胞株）の増殖を IC_{50}=340 nM で阻止します。						
Flt3 Inhibitor II	896138-40-2	292.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	343021-1MG	43,100
[Bis-(5-hydroxy-1H-indol-2-yl) methanone]	細胞透過性の対称性インドリルメタゾン化合物。Flt3 の ATP 競合阻害剤として作用し（hFlt3 に対する IC_{50} = 33 nM、EOL-1 細胞においては 40 nM）、PDGFR に対して、ある程度の選択性を示します（hPDGFRβ に対する IC_{50} = 171 nM、Swiss 3T3 繊維芽細胞においては 300 nM）。また、より高い濃度では Kit、Abl および Bcr-Abl の活性にも影響を及ぼします（それぞれ、KitV558D 変異体および野生型 Kit を発現している FDC-P1 細胞における IC_{50} = 500 nM および 0.5 ～ 2.0 μM、c-Abl 触媒ドメインについては 1.3 μM、K562 細胞においては 4.2 μM）。初代培養ヒト AML 芽球においてアポトーシスを強力に誘導し、抗増殖性を示すことが明らかにされています（Flt3 または Flt3-ITD を過剰発現している 32Dcl3 細胞における IC_{50} =約 100 nM）。						
Flt3 Inhibitor III	852045-46-6	365.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	343022-5MG	41,000
[(5-Phenyl-thiazol-2-yl)-(4-(2-pyrrolidin-1-yl-ethoxy)-phenyl)-amine; 5-Phenyl-N-(4-(2-(1-pyrrolidinyl) ethoxy) phenyl)-2-thiazolamine]	細胞透過性の 5- フェニル -2- チアゾールアミン化合物。抗増殖性を示します（MV4-11、BaF3-Flt3-ITD、BaF3-Flt3-D835/Y および BaF3-Flt3-F691/I 細胞における IC_{50} = 52 nM、240 nM、760 nM および 4.1 μM）。19 種類のキナーゼパネルにおいて Flt3 の強力な ATP 競合阻害剤として作用し（IC_{50} = 50 nM）、c-Kit、KDR、c-Abl、Cdk1、c-Src および Tie-2 には選択性（IC_{50} = 260 nM、910 nM、1.2 μM、2.1 μM、2.8 μM、8.0 μM）を示します（他のキナーゼに対しては IC_{50} > 10 μM）。						
Flt3 Inhibitor IV	819058-89-4	224.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（40 mg/ml）or Ethanol（30 mg/ml）	343023-5MG	34,000
4-(4-Aminophenyl)-1H-indazol-3-ylamine	3-アミノインダゾール化合物。Flt3 の強力な ATP 競合阻害剤として作用し（IC_{50} = 43 nM）、KDR/VEGFR-2 および c-Kit（IC_{50} = 4.79 μM および 7.36 μM）に対するよりはるかに高い選択性を示します。						
cFMS Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor	870483-87-7	366.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）	344036-1MG	24,900
[CSF-1 Receptor Inhibitor; 5-(3-Methoxy-4-((4-methoxybenzyl) oxy) benzyl)-pyrimidine-2,4-diamine]	細胞透過性のジアミノピリミジン化合物。cFMS キナーゼに対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用し（IC_{50} = 30 nM）、他の 26 種類のキナーゼに対してはほとんど阻害作用を示しません（IC_{50} > 5 μM）。*in vitro* で cFMS を介した細胞機能を選択的に阻害し、*in vivo* で CSF-1 依存性の腫瘍増殖を選択的に抑制することが知られています。						
cFMS Receptor Inhibitor II	959860-85-6	368.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	344037-1MG	21,000
4-(3,4-Dimethylanilino)-7-(4-pyridyl) quinoline-3-carboxamide	細胞透過性のアニリノキノリン化合物。cFMS キナーゼの強力かつ可逆的な活性部位ターゲティング阻害剤として作用し（IC_{50}= 80 nM）、約 500 倍高い細胞選択性を示します（c-fms を発現したマウス骨髄 M-NSF-60 細胞における IC_{50}= 100 nM、cFMS 非発現 NSO 細胞における IC_{50}> 50 μM）。						
cFMS Receptor Inhibitor III	959861-21-3	445.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）	344038-1MG	21,000
4-(3,4-Dimethylanilino)-7-(4-(methylsulfonyl) phenyl) quinoline-3-carboxamide	細胞透過性のアニリノキノリン化合物。cFMS キナーゼの強力かつ可逆的な活性部位ターゲティング阻害剤として作用し（IC_{50} = 8 nM）、100 倍高い細胞選択性を示します（c-fms を発現したマウス骨髄 M-NSF-60 細胞における IC_{50} = 100 nM、cFMS を発現しない NSO 細胞における IC_{50} = 10 μM）。						
cFMS Receptor Inhibitor IV	959626-45-0	378.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	344039-5MG	39,000
5-Cyano-N-(2,5-di (piperidin-1-yl) phenyl) furan-2-carboxamide	細胞透過性のフランカルボキサミド化合物。cFMS キナーゼ活性の強力、可逆的かつ ATP 競合的な阻害剤として作用します（CSF-1R/HEK-293E 細胞における IC_{50} = 17 nM; 76 nM）。						
InSolution™ cFMS Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor		366.4		-20℃		344041-1MG	24,900
	細胞透過性のジアミノピリミジン化合物。cFMS キナーゼ活性の強力かつ選択的な ATP 競合的阻害剤として作用します（IC_{50} = 30 nM）。他の 26 種類のキナーゼのパネルに対してはほとんど阻害を示しません（IC_{50} > 5 μM）。*in vitro* での cFMS を介した細胞機能ならびに *in vivo* での CSF-1 依存性腫瘍成長を選択的に阻害することが知られています。						
Geldanamycin, *Streptomyces hygroscopicus*	30562-34-6	560.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（1 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffers just prior to use.	345805-100UG	48,900
	マウスリンパ芽球腫細胞の $p60^{c\text{-}src}$ チロシンキナーゼおよび *c-myc* 遺伝子発現を阻害するベンゾキノイド系抗生物質。多様な種類の細胞に対して、Abl、ErbB、Fps、Src および Yes の形質転換活性を阻害します。乳がん細胞の $p185^{c\text{-}erbB2}$ プロテインチロシンキナーゼを急速に枯渇させます。HSP90 と結合し、Raf1-HSP90 複合体を分裂させることで Raf1 が不安定化を引き起こします。c-Jun の基底発現および低酸素症の誘導による発現を阻害し（IC_{50} = 75 nM）、低酸素症の誘発による c-Jun N 末端キナーゼ活性の上昇を阻止します。また、多くの乳がん、白血病および前立腺細胞株に由来する変異 p53 タンパク質を選択的に不安定化することも知られています。						

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Genistein （4′,5,7-Trihydroxyisoflavone）	446-72-0	270.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	345834-20MG 345834-50MG	21,900 34,000
	上皮成長因子受容体キナーゼの自己リン酸化作用を含めた、プロテインチロシンキナーゼの作用を阻害します（IC_{50} = 2.6 μM）。この阻害作用は、ATP に対して競合的であり、リン酸受容物質に対して非競合的です。PKA および PKC の活性に対する作用はわずかです（IC_{50} > 350 μM）。腫瘍細胞の増殖を阻害し、腫瘍細胞の分化を誘導します。Jurkat T 白血病細胞の細胞周期を停止させてアポトーシスを引き起こします。しかし、抗 CD3 モノクローナル抗体の誘導による胸腺のアポトーシスは阻害します。また、*in vitro* でトポイソメラーゼ II の活性を阻害します。						
Genistin （Genistein, 7-O-β-D-Glucopyranoside）	529-59-9	432.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	345836-5MG	27,900
	大豆を原料とする食品中に存在するイソフラボングリコシドです。PTK 阻害物質 Genistein（製品番号 345834）の不活性アナログであるので、Genistein のネガティブコントロールとして使用できます。卵巣摘出ラットにおける骨量減少の抑制も報告されています。						
GTP-14564 （3-Phenyl-1H-benzofuro[3,2-c]pyrazole; 1-Phenyl-3-H-8-oxa-2,3-diaza-cyclopenta[a]inden）	34823-86-4	234.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	371806-5MG	24,000
	細胞透過性の 3 環系 benzofurano-indazolo 化合物。クラス III 受容体チロシンキナーゼに対する強力かつ特異的な阻害剤として作用します［IC_{50} = 0.3 μM（c-fms、c-kit、wt-FLT3 および ITD-FLT3）、1.0 μM（PDGFRβ）］。KDR、EGFR、HER2、Abl、Src、PKA、AKT、PKC、MEK、および ERK1/2 の活性には影響を与えません（IC_{50} ≥ 10 μM）。Ba/F3 細胞において wt-FLT3 と ITD-FLT3 によって活性化されるシグナル伝達経路を識別するために有効に利用されています。						
Herbimycin A, *Streptomyces sp.* （70563-58-5）	70563-58-5	574.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（1 mg/ml）. Further dilute with H_2O or aqueous buffers just prior to use.	375670-100UG	39,900
	細胞浸透性の強力なプロテインチロシンキナーゼ阻害剤。$p60^{c\text{-}src}$（IC_{50} = 900 nM）および PDGF の誘導によるフォスフォリパーゼ D の活性化（IC_{50} = 8 μg/ml）を阻害します。c-Src に関連した骨吸収の阻害（IC_{50} = 70 nM）が報告されています。 鶏卵漿尿膜の血管新生を阻害します。また抗 CD3 モノクローナル抗体の誘導による胸腺細胞のアポトーシスを阻害することが示されています。						
HNMPA-(AM)3 （Hydroxy-2-naphthalenylmethylphosphonic Acid Trisacetoxymethyl Ester; Pro-drug II）		454.4	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO（20 mg/ml）or Ethanol（20 mg/ml）	397100-5MG	30,000
	細胞質エステラーゼによる開裂を受けて HNMPA を生成する HNMPA の細胞浸透性アナログ。分離ラット脂肪細胞のインスリン受容体チロシンキナーゼ（IC_{50} = 100 μM）、およびインスリン刺激グルコース酸化（IC_{50} = 10 μM）を阻害します。またヒトインスリン受容体のチロシン自己リン酸化の阻害も報告されています（IC_{50} = 200 μM）。						
7BIO （2′Z,3′E）-7-Bromoindirubin-3′-oxime, Indirubin-3′-monoxime, 7-Bromo, 7-Bromoindirubin-oxime	916440-85-2	356.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	402087-5MG	37,000
	Flt3（IC_{50} = 340 nM）とカスパーゼ依存性の非アポトーシス細胞死誘発剤（IC_{50} の 6.0 μM から 22.0 μM の細胞生存範囲）の ATP 競合阻害剤として働く細胞透過性 6-BIO（Cat. Nos. 361550 ならびに 361552）構造異性体。別の 75 種類のキナーゼに対する阻害の研究によって、TSF1、Aurora-A、Aurora-B（それぞれ IC_{50} = 3.3、4.7、6.6 μM、）を含む 14 種類のキナーゼのグループでは 10 ～ 80 倍の選択性があり、キナーゼ 15 種類の 2 番目のグループでは最大 280 倍の選択性があり、そして残りのパネル（（IC_{50} >100 μM）のキナーゼ 46 種類に対しては活性がほとんどないことが明らかになりました。						
IGF-1R Inhibitor, PPP （Insulin-like Growth Factor-1 Receptor Inhibitor; Picropodophyllin）	477-47-4	414.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	407247-1MG	24,900
	細胞膜透過性の *cis*- シクロリグナン化合物。*in vitro, in vivo* 双方で、IGF-1R の強力かつ特異的な阻害剤として作用します。*in vitro*［IC_{50} = 1 nM（無細胞系キナーゼアッセイ）；60 nM および < 50 nM（メラノーマ細胞株における細胞生存率および受容体自己リン酸化）］、*in vivo*（SCID マウスにおいて 20 mg/kg/12 hr s.c. で IGF-1R 依存性腫瘍細胞増殖を完全に阻害）。毒性作用はほとんど示しません（LD_{50} > 500 mg/kg）。IR、FGFR、PDGFR および EGFR に対する作用はほとんどなく、微小管および DNA トポイソメラーゼ II には作用を示しません。活性化ループ内で Y1136 をリン酸化します。本品は、IGF-1R と IR を識別することが報告された最初の阻害剤です。						
IGF-1R Inhibitor II ［N-（2-Methoxy-5-chlorophenyl）-N′-（2-methylquinolin-4-yl）-urea］		341.8	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（3 mg/ml）	407248-10MG	36,900
	細胞透過性のフェニルキノリニル尿素化合物。IGF-1R の自己リン酸化を阻害します（MCF-7 細胞におけるリガンド誘導性自己リン酸化の阻害について IC_{50} = 12 μM、無細胞キナーゼアッセイにおいて IC_{50} < 1 μM）。IGF-1R に依存的な腫瘍細胞増殖を *in vitro*（MCF-7 および MCNeuA について、それぞれ IC_{50} = 8 および 15 μM）とマウス *in vivo*（週 3 回 100 mg/kg の腹膜内投与で 80% の低下）の両方で抑制します。阻害のメカニズムにはおそらく ATP 結合の間接的な阻害が関係しているものと考えられます。						
InSolution™ JAK Inhibitor I ［2-（1,1-Dimethylethyl）-9-fluoro-3,6-dihydro-7H-benz[h]-imidaz[4,5-f]isoquinolin-7-one; P6; Pyridone 6］	457081-03-7	309.3	≥ 98% by HPLC	+4℃		420097-500UG	22,900
	DMSO に JAK 阻害剤 I（製品番号 420099）の 10 mM（500 μg/162 μl）溶液。						
JAK Inhibitor I ［2-（1,1-Dimethylethyl）-9-fluoro-3,6-dihydro-7H-benz[h]-imidaz[4,5-f]isoquinolin-7-one; P6; Pyridone 6］	457081-03-7	309.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	420099-500UG	23,900
	JAK（Janus Protein Tyrosine Kinase）の強力な阻害剤。JAK1（マウス JAK1 に対する IC_{50} = 15 nM）、JAK2（IC_{50} = 1nM）、JAK3（K_i = 5 nM）および Tyk2（IC_{50} = 1 nM）に対して、強力な阻害活性を示します。						
JAK3 Inhibitor I ［4-（4′-Hydroxyphenyl）amino-6,7-dimethoxyquinazoline; WHI-P131］		297.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）	420101-5MG	33,900
	強力かつ特異的な JAK3（Janus ファミリーキナーゼ 3）の阻害剤（IC_{50} = 78 μM）。JAK1、JAK2、または Zap/Syk あるいは Src チロシンキナーゼに対しては作用しません。膠芽細胞腫細胞の接着および遊走に対する強力な阻害剤として作用します。また、トロンビンの誘導による血小板凝集の阻害も報告されています。						
JAK3 Inhibitor II {4-［（3′-Bromo-4′-hydroxyphenyl）amino］-6,7-dimethoxyquinazoline; WHI-P154}	211555-04-3	376.2	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）	420104-5MG	40,000
	JAK3 の強力かつ特異的な細胞浸透性阻害剤（IC_{50} = 5.6 μM）。JAK1 あるいは JAK2 には作用しません。DT-40 細胞の電離放射線誘導性 *c-jun* 活性化の阻害も示されています。また膠芽腫細胞の接着と遊走に対する強力な阻害剤としても作用します。						
JAK3 Inhibitor IV ［2-Naphthyl-（N-isopropyl,N-benzyl）-β-aminoethylketone, HCl; ZM 39923］	58753-54-1	367.9	≥ 99% by HPLC	-20℃	DMSO（36 mg/ml）	420121-10MG	50,000
	Janus チロシンキナーゼ 3（JAK3）の強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤（pIC_{50} = 7.1）として働く β-（アミノエチル）ケトン系プロドラッグ。						
JAK3 Inhibitor V ［（2-Naphthylvinyl Ketone）; ZM 449829］	932258	182.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（10 mg/ml）	420122-10MG	45,000
	同様な阻害活性を有する JAK3 Inhibitor-IV（製品番号 420121）の分解産物（JAK3 に対する pIC_{50} = 6.8、EGF-R では 5.0、JAK1 では 4.7）。また、STAT-5 のリン酸化および T 細胞の増殖も阻害します。						
JAK3 Inhibitor VI	856436-16-3	383.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	420126-5MG	32,000
	JAK3 の強力な阻害剤として働く細胞膜透過性の 3′- ピリジルオキシインドール化合物（IC_{50} = 27 nM）。酵素活性部位に結合して、IL-2 誘導性の細胞内 JAK3 と STAT5 のリン酸化を妨げます。IL-2 誘導性細胞増殖を阻害し（マウス CTLL およびヒト T 細胞に対して、それぞれ IC_{50} = 760 および 250 nM）、Dexamethasone（製品番号 265005）に匹敵する効力で、マウスにおけるオキサゾロン誘導性の耳浮腫を軽減します。						
JAK2 Inhibitor II （1,2,3,4,5,6-Hexabromocyclohexane）	1837-91-8	557.5	≥ 99% by titration	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	420132-25MG	23,000
	細胞膜透過性の、ヘキサブロモシクロヘキサン化合物。JAK2 の活性化ループ近傍の溶媒露出ポケットと相互作用する阻害剤。JAK2 自己リン酸化の特異的な直接阻害剤です（JAK2 を過剰発現している BSC-40 細胞において 50 μM で最大阻害）。成長ホルモン受容体と JAK2 を安定的に発現している g2A 細胞株において成長ホルモンを介した JAK2 の活性化を減少させます。マウス線維芽細胞の EGFR 自己リン酸化はブロックしません。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
JAK3 Inhibitor VII, AD412 N-(Pyridin-4-yl)-3-[1-(4-chlorobenzyl) indol-3-yl]-propanamide	796041-65-1	389.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml） JAK2（それぞれ 90 μM と 30 μM のとき 29 % と 0 %）ではなく JAK3（それぞれ 90 μM と 30 μM のとき 81% と 36%）のキナーゼ活性を選択的に阻害し、INF-γ- 刺激 U266 培養による JAK1/2 依存性 STAT1 リン酸化ではなく、IL-2- 刺激 CTL-L2 細胞において Akt、STAT5a/b、Erk1/2 の JAK1/3- 依存性リン酸化を低減することを示す細胞透過性のインドール -3- プロミオンアミド免疫抑制剤。ConA 刺激マウス脾細胞ならびに PHA 刺激ヒト PBL 増殖（IC_{50} = それぞれ 17 ならびに 25 μM）*in vitro* を阻害し、マウスでの過敏反応の遅れを改善（~78%、1 日経口用量 50 mg/kg）したり、心臓移植を受けたラットの延命（>3 倍、60 mg/kg/ 日、経口投与）をしたりするのに有効と報告されています。	420145-25MG	17,000
JAK3/GSK-3 β /PKC α Inhibitor	1260181-14-3			+2℃～+8℃		420148-5MG	28,900
Lavendustin A {5-Amino-[(N-2,5-dihydroxybenzyl) -N′-2-hydroxybenzyl]salicylic Acid; RG14355}	125697-92-9	381.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO or Ethanol（10 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffer just prior to use. EGF 受容体チロシンキナーゼ（IC_{50} = 11 nM）および $p60^{c\text{-}src}$（IC_{50} = 500 nM）の細胞浸透性阻害剤。プロテインキナーゼ A あるいはプロテインキナーゼ C に対してはほとんど作用しません（IC_{50} > 200 μM）。また NMDA の刺激による cGMP 産生を阻害します（IC_{50} = 30 nM）。抗増殖性を示します。ラットの血管内皮成長因子（VEGF）による血管新生作用を抑制します。	428150-1MG	32,000
Lck Inhibitor [4-Amino-5-(4-phenoxyphenyl)-7H-pyrrolo [3,2-d]pyrimidin-7-yl-cyclopentane]	213743-31-8	370.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（17 mg/ml） 細胞透過性のピロロピリミジン化合物。lck に対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します [ATP 濃度 5 μM での IC_{50} =< 1 nM（lck64-509 Y394）、2 nM（lckcd pY394）、70 nM（src）、1.57 μM（kdr）、1.98 μM（tie-2）; ATP 濃度 1 mM での IC_{50} = 16 μM（lck64-509 Y394）、66 nM（blk）、126 nM（fyn）、420 nM（lyn）、5.18 μM（csk）]。他のキナーゼの活性にはほとんど影響を与えません [IC_{50} = 3.2 μM（EGFR）、> 33 μM（PKC）、> 50 μM（CDC2/B）、> 50 μM（ZAP-70）]。刺激による IL-2 産生を強力に抑制し、Jurkat T 細胞における IC_{50} < 1-40 nM（*in vitro*）、マウス腹腔内における ED_{50} = 4 mg/kg（*in vivo*）であることが明らかになっています。	428205-1MG	24,900
Lck Inhibitor II [3-(2-(1H-Benzo[d]imidazol-1-yl)-6-(2-morpholinoethoxy) pyrimidin-4-ylamino)-4-methylphenol]		446.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（35 mg/ml）or Ethanol（20 mg/ml） 細胞透過性の 3 置換ピリミジン化合物。リンパ球特異的キナーゼを強力に阻害し（IC_{50} = 3 nM ; [ATP] = 10 μM）、刺激 Jurkat 細胞における IL-2 の産生を抑制します（IC_{50} = 54 nM）。	428206-5MG	48,900
Lck Inhibitor III [2-(1H-Benzo[d]imidazol-1-yl)-N-(5-methoxy-2-methylphenyl)-6-(2-morpholinoethoxy) pyrimidin-4-amine, hydrate]		478.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（18 mg/ml）or Ethanol（25 mg/ml） 細胞透過性の ATP 結合部位を標的とした 3 置換ピリミジン化合物。Lck（リンパ球特異的キナーゼ）を阻害します。（IC_{50} = 867 nM ; [ATP] = 10 μM） CD3 クロスリンキングおよび PMA で刺激した Jurkat E6-1 T 細胞における IL-2 の放出を抑制します（IC_{50} = 1.27 μM）。Lck Inhibitor II（製品番号 428206）ほど強力ではありませんが、より溶解性があり（27 μg/ml in 50 mM PBS、pH 7.4、イオン強度 0.15 M）また *in vivo* での生体利用効率（F = 22%、p.o. and *i.v.* at 10 mg/kg）を示します。	428207-5MG	43,900
LFM-A13 [α-Cyano-β-hydroxy-β-methyl-N-(2,5-dibromophenyl) propenamide]	62004-35-7	360	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（200 mg/ml） Bruton's Tyrosine Kinase（BTK）の強力かつ特異的阻害剤（*in vitro* でヒト BTK に対して IC_{50} = 17.2 μM、組換え BTK に対して IC_{50} = 2.5 μM）。EGFR、HCK、IRK JAK1 および JAK2 などの他のプロテインチロシンキナーゼの酵素活性に対しては、278 μM でも影響しません。セラミドおよびビンクリスチン誘導性アポトーシスに対する、BTK 陽性 B 系白血病細胞の化学的感受性を促進します。	435300-5MG	27,900
Mer RTK Inhibitor, UNC569				+2℃～+8℃		445835-10MG	38,900
Met Kinase Inhibitor [(3Z)-N-(3-Chlorophenyl)-3-((3,5-dimethyl-4-((4-methylpiperazin-1-yl) carbonyl)-1H-pyrrol-2-yl) methylene)-N-methyl-2-oxo-2,3-dihydro-1H-indole-5-sulfonamide; SU11274]	658084-23-2	568.1	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（1 mg/ml）. Warm as needed for complete solubilization. 細胞透過性のピロールインドリノン化合物。Met キナーゼ活性の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 20 nM）。Flk に対するよりも 60 倍以上、Ron、FGFR-1、c-Src、Cdk2、PDGFRb、EGFR および Tie-2 に対するよりも 400 倍高い選択性を示します。さまざまな癌細胞株において HGF/SF が刺激する細胞内シグナル伝達と Met 媒介性腫瘍形成を阻害することが示されています。	448101-1MG	19,000
Met/Flt-3/VEGFR2 Tyrosine Kinase Inhibitor		458.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（1 mg/ml） 細胞透過性のピロロピリジン - ピリドン化合物。Met、Flt-3 および血管内皮増殖因子受容体 2（VEGFR2）の強力かつ ATP 競合的な可逆的阻害剤として作用し（IC_{50} はそれぞれ 1.9、4.0 および 27 nM）、Lck、c-Kit、Cdk2/E、IGF-1R、InsR、MK-2、PKCa および PKA よりもはるかに高い選択性を示します（IC_{50} はそれぞれ 0.29、0.61、> 1、> 5、> 5、> 10、> 30 および > 30 μM）。GTL-16 胃腫瘍細胞の増殖を停止し（IC_{50} = 60 nM）、異種移植マウスモデルにおいて抗腫瘍作用を示すことが判明しています（25 mg/kg、経口投与）。	448103-5MG	44,000
c-Met/RON Dual Kinase Inhibitor	959122-11-3	556.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（40 mg/ml） Lck、Tie2、Src、BTK、IGFR あるいは VEGFR2（IC_{50} = それぞれ 160、400、410、710、1000、1900 nM）に対してずっと弱い有効性を示し、B-Raf や 20 以上のキナーゼ（IC_{50} >1 μM）に対しての活性はほとんど、あるいは全く示さない一方で、HGF のキナーゼ活性受容体 c-Met ならびに MSP（マクロファージ刺激タンパク質）受容体 RON（IC_{50} = 4 and 9 nM、respectively）に対して有効な阻害剤として働く細胞透過性キノリン化合物。構造的な活性突然変異体の TPR-Met ならびに RONδ160（それぞれ NIH3T3 TRP-Met ならびに HT-29 培養）と同様、野生型 c-Met（HT-29 ならびに BxPC3 培養）と RON（NIH3T3 RON ならびに BxPC3 培養）のリガンド誘発の自己リン酸化を効果的に抑制することを示します。用量依存的に *in vivo*（経口服用 100 mg/kg の 1 日の完全阻害）マウスにおいて NIH3T3 TRP-Met ならびに U-87 腫瘍増殖を阻害しますが、腫瘍 *in vivo* 増殖が V600E B-raf にも依存しているに対して有効性が低いことが報告されています。	448104-5MG	38,900
c-Met Kinase Inhibitor III 2-(6-((R)-1-(2,6-dichloro-3-fluorophenyl) ethoxy) quinolin-3-yl) cyclopropanecarboxamide		419.28	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml） 酵素アッセイにおいて 19 種類の受容体チロシン・キナーゼと 8 種類のセリン／スレオニンキナーゼのパネルに対して 20 倍以上の選択性の c-Met（IC_{50} = 9.3 nM）に対する ATP 競合阻害剤として働く A 6-Benzyloxyquinoline 誘導体。また、*in vitro* の HUVEC 培養において MKN45 細胞成長阻害（IC_{50} = 93 nM）を示し、HDG 依存性抗増殖活性（IC_{50} = 300 nM）を示します。	448105-2MG	33,000
Met Kinase Inhibitor VI, SGX523	1022150-57-7	359.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO	448106-5MG	23,000
Neurotrophin Antagonist, Y1036 3-[4-Oxo-5-[[5-(4-sulfamoylphenyl)-2-furyl] methylene]-2-thioxo-thiazolidin-3-yl]propanoic acid		438.5	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml） 非ニューロトロフィン成長因子 EGF ならびに PDGF の受容体結合に対して何ら影響を示さない一方、BDNF（製品番号 203702）ならびに NGF（製品番号 480352）（KD = それぞれ 3.5 ならびに 3.0 μM）を結合し、細胞表面受容体（IC_{50} に対して BDNF/p75NTR、BDNF/trkB、NGF/p75NTR、NGF/trkA 相互作用 = それぞれ 6.2、3.7、5.7、8.8 μM、PC12 培養において）との相互作用を防ぐフリールチオキソチアゾリジノン化合物。40 μM 時の Y1036 は、ダウンストリーム Erk のリン酸化と同様に、それぞれ 40 pM の BDNF と NGF 処理で trkA と trkB のリン酸化反応を阻害することが示されています。Y1036 は、また、用量依存的にラット胚後根神経節における B DNF ならびに NGF 誘発性の神経細胞突起成長を阻害することが示されています。	480870-10MG	26,900
InSolution™ PD 98059	167869-21-8	267.3	≥ 98% by HPLC	-20℃		513001-1ML	21,000
					無水 DMSO に PD 98059（製品番号 513000）の 5 mg/ml 溶液。		
PD 168393 {4-[(3-Bromophenyl)amino]-6-acrylamidoquinazoline}		369.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml） EGF レセプター（EGFR）のチロシンキナーゼ活性を強力に阻害する細胞浸透性の非可逆的・選択的阻害剤（IC_{50} = 700 pM）。他のプロテインキナーゼは阻害しません。EGFR の触媒ドメインに 1:1 で結合し、Cys^{773} をアルキル化することにより作用します。*in vivo* で優れた抗がん剤として働きます。	513033-1MG	28,900

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
PD 158780	171179-06-9	330.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	513035-500UG	29,000
{4-[(3-Bromophenyl)amino]-6-(methylamino)-pyrido[3,4-d]pyridimine}	EGFR チロシンキナーゼ活性の強力なインヒビター（8 pM）。また、SK-BR-3（IC_{50} = 49 nM）および MDA-MB-453（IC_{50} = 52 nM）乳がんにおけるヘレグリン刺激自己リン酸化も阻害します。この阻害は競合的で、酵素の ATP 部位へのインヒビターの結合から生じるものです。HeLa 細胞および NIH 3T3 細胞において、LPA の刺激による MAP キナーゼキナーゼ 1/2（MKK1/2）の活性化、および EGFR のチロシンリン酸化を阻害します。						
InSolution™ PD 158780	171179-06-9	330.2	≥ 95% by HPLC	-20℃		513036-500UG	30,900
	DMSO に PD 158780（製品番号 513035）の 10 mM（500 µg/151 µl）溶液。						
PD 174265	216163-53-0	371.2	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	513040-1MG	25,000
{4-[(3-Bromophenyl)amino]-6-propionylamidoquinazoline}	EGF レセプター（EGFR）のチロシンキナーゼ活性を強力に阻害する細胞浸透性の可逆的・選択的阻害剤（IC_{50} = 450 pM）。この化合物は可逆的な性質をもつことから、PD 168393（製品番号 513033）よりも抗腫瘍効果が低いといえます。						
PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor II	249762-74-1	346.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	521231-1MG	42,000
{(5-Butanoate-1H-2-indolyl)(1H-2-indolyl)-methanone; D-65476; [2-(1H-2-Indolylcarbonyl)-1H-5-indolyl]butanoate}	細胞透過性のビス（1H-2- インドリル）-1- メタノン化合物。血小板由来増殖因子（PDGF）受容体チロシンキナーゼに対する選択性の高い ATP 競合阻害剤として作用します [IC_{50} = 1.1 µM（Swiss 3T3 細胞 PDGFR）]。Flt3（Fms 様チロシンキナーゼ 3）活性も強力に阻害します [IC_{50} = 6.2 µM（hPDGFβ-R-mFlt3）、50 nM（EOL-1 細胞）]。32D 細胞の放射線誘導アポトーシス感受性を引き起こし、TEL-Flt3 導入 BA/F3 細胞の増殖を阻害します（IC_{50} < 300 nM）。Platelet Derived Growth Factor Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor I（製品番号 521230）のプロドラッグとして細胞に使用することもできます。						
PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor III	205254-94-0	485.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	521232-1MG	29,900
[4-(6,7-Dimethoxy-4-quinazolinyl)-N-(4-phenoxyphenyl)-1-piperazinecarboxamide]	細胞透過性のピペラジニル - キナゾリン - カルボキサミド化合物。PDGF 受容体ファミリーのチロシンキナーゼに対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します [IC_{50} = 0.05 µM（α-PDGFR）、0.08 µM（β-PDGFR）、0.05 µM（c-Kit）、0.23 µM（Flt3）]。極めて高濃度でのみ他のキナーゼの活性に影響を与えます [IC_{50} > 30 µM（EGFR、FGFR、Src、PKA、および PKC）]。PDGF-BB によって誘導されたブタ大動脈平滑筋細胞の増殖を抑制することが報告されています（IC_{50} = 0.25 µM）。						
PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor IV	627518-40-5	325.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）or Methanol（5 mg/ml）	521233-1MG	39,900
[3-Fluoro-N-(6,7-dimethoxy-2,4-dihydroindeno[1,2-c]pyrazol-3-yl)phenylamine]	いくつかのヒト腫瘍細胞系で強力かつ選択的な増殖抑制特性（IC_{50} < 33 nM）を示す細胞膜透過性インデノピラゾール化合物。PDGFR（-β、-α についてそれぞれ IC_{50} = 4.2 nM、45 nM）及び c-Abl（IC_{50} = 22 nM）の ATP 競合・可逆的阻害剤として作用することが示されています。lck、c-Src、Fyn（それぞれ IC_{50} = 100 nM、185 nM、378nM）に対する中程度の選択性を示し、VEGFR、HER-2、Cdks-1、-2、-4、-7、bFGFR-1 および EGFR（それぞれ IC_{50} = 3.1 µM、> 10 µM、> 10 µM、45.8 µM、> 100 µM）はほとんど阻害しません。						
PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor V	347155-76-4	527.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）	521234-1MG	43,900
[N-(4-((6,7-Dimethoxy-4-quinoyl)oxy)phenyl)-N'-(2-methylbenzoyl)thiourea]	細胞透過性のキノリニルチオ尿素化合物。PDGFR の強力な可逆性 ATP 競合阻害剤として作用します（リガンド誘導性の細胞 PDGFR リン酸化および *in vitro* キナーゼ活性に関して、それぞれ IC_{50} = 4 および 7.6 nM）。非常に高い濃度でのみ、c-kit 受容体を阻害します（受容体リン酸化およびキナーゼ活性に関して、それぞれ IC_{50} = 434 および 234 nM）。*in vivo* ラット頸動脈バルーン外傷モデルにおいて新生内膜形成を強力に阻害することが示されています（30 mg/kg、p.o.）。						
PDGFR Tyrosine Kinase Inhibitor VI, SU6668	210644-62-5	310.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml）	521235-5MG	43,900
(Z)-3-(2,4-Dimethyl-5-(2-oxo-1,2-dihydro-indol-3-ylidenemethyl)-1H-pyrrol-3-yl)-propionic acid	細胞透過性のインドリノン化合物。PDGF-Rβ の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し、VEGF-R2（Flk-1/KDR）、FGF-R1 および EGF-R に対するより高い選択性を示します（*in vitro* キナーゼスクリーニングにおける IC_{50} = 0.06、2.43、3.04、> 100 µM、各受容体を過剰発現した細胞ベースアッセイにおける IC_{50} = 0.03 ～ 0.1 µM（NIH-3T3 細胞）、3 ～ 10 µM（HUVEC）、10 ～ 50 µM（NIH-3T3 細胞）および > 100 µM（NIH-3T3 細胞））。Aurora-B を強力に阻害し（IC_{50} = 47 nM）、Aurora-A、TBK1、AMPK、Lyn、IKK-3、Yes（IC_{50} = 0.85、1.4、1.8、4.3、5.2、5.8 µM）ならびに IGF-1R、Met、Src、Lck、ZAP70、Abl および Cdk2（IC_{50} ≥ 10 µM）に対するより高い選択性を示します。MO7E 細胞における SCF 誘導性の c-kit リン酸化を抑制します（IC_{50} = 0.1 ～ 1 µM）。細胞増殖を阻害し、アポトーシスを誘導し、血管新生抑制作用および抗腫瘍作用を示すことが報告されています。						
PDGFR/VEGFR2 Tyrosine Kinase Inhibitor, 5-Br SU6668	251356-32-8	389.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	521236-5MG	39,000
(Z)-3-(2,4-Dimethyl-5-(2-oxo-1,2-dihydro-indol-3-ylidenemethyl-5-bromo)-1H-pyrrol-3-yl)-propionic acid	PDGFR Tyrosine Kinase Inhibitor VI、SU6668（製品番号 521235）の 5- ブロモインドリノンアナログ。細胞透過性。PDGF-Rβ/VEGF-R2（Flk-1/KDR）の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し、FGF-R1 や EGF-R に対するより高い選択性を示します（*in vitro* キナーゼスクリーニングにおける IC_{50}=0.06、1.73、2.05、過剰発現受容体の細胞ベースアッセイでの IC_{50}= 3.65 µM（NIH-3T3 細胞）、0.07 µM（HUVEC）、3.60 µM（NIH-3T3 細胞）、> 50 µM（NIH-3T3 細胞））。						
PDGFR Tyrosine Kinase Inhibitor VII	251356-45-3	386.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）. Insoluble in Ethanol.	521237-5MG	23,500
(Z)-3-(2,4-Dimethyl-5-(2-oxo-1,2-dihydro-indol-3-ylidenemethyl-6-phenyl)-1H-pyrrol-3-yl)-propionic acid	細胞透過性のインドリノン化合物。ATP 部位を標的とする強力な PDGFR 阻害剤として作用しますが、Flk-1/KDR/ VEGFR2、FGFR1、および EGFR にははるかに高濃度でしか作用しません（それぞれ IC_{50} = 0.14、2.29、および >100 µM）。EGFR 発現 NIH 3T3 培養細胞において PDGFβ 刺激による増殖を EGF 刺激に対してより選択的に阻害し（それぞれ IC_{50} = 0.11 および 21.9 µM）、FGF または VEGF 刺激時の HUVEC 細胞の増殖に対してははるかに弱い作用を示します（IC_{50} = 10 µM）。						
PDK1 Inhibitor II	850717-64-5	282.3	≥ 95% by HPLC (sum of two isomers)	+4℃	DMSO（25 mg/ml）	521276-5MG	20,900
BX-517	より高い濃度でのみ PKA（IC_{50} = 1.6 µM）と 他の 7 種類のキナーゼに影響を及ぼす一方、有効な ATP 部位を標的とした PDK1 阻害剤（IC_{50} = 6 nM）として働き、PC-3 培養（IC_{50} ≤ 1 µM）における細胞 Akt Thr308 リン酸化反応レベルを効果的に抑制する細胞透過性のインドリノン化合物。その *in vivo* 適用性は、低い水溶解度（PBS の 2 µg/ml）ならびに不十分な薬物動態により限定されています。						
PDGFRβ/RAF Kinase Inhibitor		459.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	521238-10MG	40,000
Polo-like Kinase Inhibitor III		477.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	528284-500UG	18,900
PP2	172889-27-9	301.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（20 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffers just prior to use.	529573-1MG 529573-5MG	20,000 25,000
[AG 1879; 4-Amino-5-(4-chlorophenyl)-7-(*t*-butyl)pyrazolo[3,4-d]pyrimidine]	プロテインチロシンキナーゼ Src ファミリーの強力かつ選択的阻害物質。$P56^{lck}$（IC_{50} = 4 nM）、$p59^{fynT}$（IC_{50} = 5 nM）および Hck（IC_{50} = 5 nM）を阻害します。EGFR キナーゼ（IC_{50} = 480 nM）、JAK2（IC_{50} > 50 µM）あるいは ZAP-70（IC_{50}>100 µM）の活性には大きく影響しません。フォーカルアドヒージョンキナーゼの活性化およびその Tyr^{577} 座位におけるリン酸化を阻害します。また抗 CD3 抗体の刺激によるヒト T 細胞のチロシンリン酸化も強力に阻害します（IC_{50}=600 nM）。						
PP3	5334-30-5	211.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO. Further dilute with aqueous buffers just prior to use.	529574-1MG	15,900
(4-Amino-7-phenylpyrazol[3,4-d]pyrimidine)	Src ファミリープロテインチロシンキナーゼ阻害物質 PP2（製品番号 529573）用のネガティブコントロール。ただし EGFR キナーゼの活性を阻害します（IC_{50} = 2.7 µM）。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
InSolution™ PP2		301.8	≥ 95% by HPLC	-20℃		529576-1MG	25,900
	DMSO に PP2（製品番号 529573）の 10 mM（1 mg/331 µl）溶液。						
PP1 Analog		317.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	529579-1MG	26,900
[1-Na PP1; 1-NA-PP1; 4-Amino-1-*tert*-butyl-3-（1′-naphthyl）pyrazolo[3,4-d]pyrimidine]	強力な細胞浸透性の選択的 Src- ファミリーチロシンキナーゼ阻害物質。1338G v-Src（IC_{50} = 1.5 nM）に対する選択性は、野生型 v-Src（IC_{50} = 1.0 µM）に対する選択性をはるかに上回ります。また野生型 Fyn も阻害します（IC_{50}= 600 nM）。						
PP1 Analog V, 2,3-DMB-PP1	956026-24-7	309.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	529599-10MG	67,000
InSolution™ PP1 Analog	221243-82-9	317.4	≥ 97% by HPLC	-70℃		529605-1MG	33,000
RET Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor	269730-03-2	297.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	554340-10MG	35,900
1,3-Dihydro-5,6-dimethoxy-3-（（4-hydroxyphenyl）methylene）-2H-indol-2-one	Ret キナーゼ活性の強力な ATP 競合的可逆的阻害剤として作用するインドリノン化合物（IC_{50} = 170 nM）。細胞膜透過性。Shc および Met のホスホリル化を阻害し、数種の癌細胞の増殖を停止します（IC_{50} =NIH3T3^{ptc1} 細胞で 0.97 µM、NIH3T3^{MEN2A} 細胞で 3.6 µM、H460 細胞で 24.5 µM）。さらに、マウス異種移植腫瘍モデルで抗血管形成作用を発揮します（150 mg/kg の 1 日 2 回投与）。						
S6K1 Inhibitor, PF-4708671		390.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO	559273-10MG	50,900
S6K1 Inhibitor II, DG2		389.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	559274-10MG	48,900
RSK Inhibitor, SL0101		516.5	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO	559285-1MG	47,900
RSK Inhibitor II	501437-28-1	391.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	559286-5MG	58,900
ST638	107761-24-0	354.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMF or DMSO（5 mg/ml）	567790-5MG	35,000
[α-Cyano-（3-ethoxy-4-hydroxy-5-phenylthiomethyl）cinnamide]	プロテインチロシンキナーゼ阻害剤（IC_{50} = 370 nM）。肝細胞において HGF が誘導する MAP キナーゼの活性化も阻害します。また、ヒト好中球においてフォスフォリパーゼ D 活性を阻害することが示されています。モルモット好中球において pervanadate が誘導する O_2^-生産を低減します。						
Src Kinase Inhibitor I	179248-59-0	373.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	567805-1MG	28,900
4-（4′-Phenoxyanilino）-6,7-dimethoxyquinazoline	4′- フェノキシ置換 4- アニリノキナゾリン化合物。Src ファミリーチロシンキナーゼに対する強力で選択的な 2 部位への競合阻害剤として作用します［IC_{50} = 44 nM（Src）、88 nM（Lck）］。ATP 結合部位とペプチド結合部位の双方と同時に相互作用することが明らかになっています。極めて高濃度で VEGFR2（IC_{50} = 0.32 µM）および C-fms チロシンキナーゼ（IC_{50} = 30 µM）を阻害します。						
Src Kinase Inhibitor II		420.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（20 mg/ml）	567806-5MG	42,000
	置換型のトリアゾロ - キノリン -1- チオン化合物。Src ファミリーチロシンキナーゼに対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します［IC_{50} = 1.2 µM（ヒト組換え Csk）］。p38 MAPK および FGFR に対しては 50 µM の高濃度でもほとんど作用を示しません。						
Src Inhibitor PP1	72889-26-8	281.36	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO（25 mg/ml）	567809-1MG	13,900
4-amino-5-（4-methylphenyl）-7-（t-butyl）pyrazolo-d-3,4-pyrimidine	細胞透過性ピラゾロピリミジン化合物であり、*in vitro* キナーゼアッセイでは Src 型チロシンキナーゼの Lck、Fyn、Hck および Src（IC_{50} = それぞれ 5 nM、6 nM、20 nM および 170 nM）のほか、CSK、RIP2、および CK1δ などの非 Src 型キナーゼも阻害します（IC_{50} = それぞれ 640 nM、26 nM および 170 nM）。1 µM で p38α、p38b、CK1δ、CSK、RIP2 および GAK の *in vitro* キナーゼ活性は 57%以上低下します。しかし、他の 60 種以上のキナーゼに対してはるかに低い活性を示します。Src および［poly Glu-Tyr 4:1］を用いた動態試験から、阻害は基質に関しては競合的であり、ATP に関しては非競合的であることが分かっています。さらに、ヒトおよびネズミ由来の数種の培養 B リンパ腫（I_{50}= 2.5 ～ 8.0 µM）ならびに小児脳腫瘍細胞（IC_{50} = 1.1 ～ 9.7 µM）で抗増殖特性を呈します。						
Stem-Cell Factor/c-Kit Inhibitor, ISCK03	945526-43-2	355.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	569615-10MG	30,000
4-*t*-Butylphenyl-N-（4-imidazol-1-yl-phenyl）sulfonamide	細胞透過性のフェニル - イミダゾロスルフォンアミド化合物。*in vitro* c-Kit キナーゼ活性と、501 mel および HM3KO 細胞における SCF（幹細胞因子）誘導 c-Kit リン酸化（1-5 µM の範囲で完全阻害）の両方を可逆的に阻害することが知られています。HGF 依存性ではなく SCF 依存性の ERK 活性化を特異的に抑制して ERK 発現には影響を与えず、マウスモデルにおいて色素脱失を引き起こします（500 mg/kg、p.o.）。						
Ste11 MAPKKK Activation Inhibitor	331662-51-2	350.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	570100-5MG	39,000
4-（（2,4-Dichlorophenyl）amino）-6,7-dimethoxyquinazoline	キナゾリンアミン化合物。酵母において PD 153035（製品番号 234490）よりはるかに強力に Ste11 活性化シグナル伝達経路を阻害し、c-Abl キナーゼ活性を抑制します。また、Src キナーゼ活性を阻害します（IC_{50} = 250 nM）。						
SU5402		296.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）	572630-500UG 572630-1MG 572630-2MG	28,000 39,000 69,000
{3-[3-（2-Carboxyethyl）-4-methylpyrrol-2-methylidenyl]-2-indolinone}	繊維芽細胞成長因子レセプター 1（FGFR1）がもつチロシンキナーゼ活性を阻害します（1 mM ATP の存在下における IC_{50} = 10-20 µM）。また、αFGF が誘導する ERK1 および ERK2 のチロシンリン酸化も阻害します（IC_{50} = 10-20 µM）。SU4984（製品番号 572625）とは対照的に、SU5402 は PDGF 受容体のチロシンリン酸化は弱く阻害するに過ぎず、インシュリン受容体のリン酸化は阻害しません。EGF レセプターのキナーゼ活性は阻害しません。						
InSolution™ SU5402		296.3		-70℃		572631-500UG	40,000
	SU5402（製品番号 572630）の 10 mM（500 µg/169 µL）DMSO 溶液。FGFR1 の触媒ドメインと相互作用することによって FGFR1 のチロシンキナーゼ活性を阻害します（1 mM ATP の存在下で IC_{50} = 10-20 µM）。また、ERK1 および ERK2 の aFGF 誘導リン酸化を阻害します（IC_{50} = 10-20 µM）。SU4984 とは異なり、PDGF 受容体のチロシンリン酸化の弱い阻害剤としてのみ作用します。インスリン受容体のリン酸化を阻害せず、EGF 受容体キナーゼに対する阻害作用を示しません。						
SU5614		272.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	572632-1MG	35,000
{5-Chloro-3-［（3,5-dimethylpyrrol-2-yl）methylene］-2-indolinone}	VEGF（Flk-1; IC_{50} = 1.2 µM）および PDGF（IC_{50} = 2.9 µM）受容体チロシンキナーゼの強力かつ選択的な阻害剤。EGF および IGF 受容体チロシンキナーゼに対しては、まったく効果を示しません。また、ヒト臍帯静脈内皮細胞（HUVEC）の VEGF による有糸分裂誘発も阻害します（IC_{50} ≤ 680 nM）。						
SU6656	330161-87-0	371.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（25 mg/ml）	572635-1MG	36,900
	強力な Src ファミリーキナーゼ阻害剤。Src（IC_{50} = 280 nM）と同様に、近縁のキナーゼ Fyn（IC_{50} = 170 nM）および Yes（IC_{50} = 20 nM）も阻害します。また、Lyn（IC_{50} = 130 nM）も強力に阻害しますが、Lck（IC_{50} = 688 µM）および PDGF 受容体（IC_{50} > 10 µM）はただ弱く阻害するにとどまります。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
InSolution™ SU6656		371.5	≥ 95% by HPLC	+4℃		572636-500UG	23,900
	DMSO に SU6656（製品番号 572635）の 10 mM（500 µg/135 µl）溶液。						
SU11652	326914-10-7	414.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（4 mg/ml）	572660-500UG	40,900
{5-[(Z)-(5-Chloro-2-oxo-1,2-dihydro-3H-indol-3-ylidene)methyl]-N-[2-(diethylamino)ethyl]-2,4-dimethyl-1H-pyrrole-3-carboxamide}	細胞透過性のピロール - インドリノン化合物。強力かつ ATP 競合的なチロシンキナーゼ受容体血管新生阻害剤（IC_{50} = 3 nM）として作用し、EGFR より高い選択性を示します [IC_{50} = 27 nM（PDGFRβ）、170 nM（VEGFR2）、約 10 nM（FGFR1）、約 500 nM（Kit ファミリー受容体）、> 20 µM（EGFR）]。腫瘍細胞において増殖抑制作用およびアポトーシス促進作用を示すことが知られています。						
SU1498		390.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	572888-5MG	28,000
{(E)-3-(3,5-Diisopropyl-4-hydroxyphenyl)-2-[(3-phenyl-n-propyl)amino-carbonyl]acrylonitrile}	血管内皮増殖因子（VEGF）受容体キナーゼの Flk-1 キナーゼを強力かつ選択的に阻害（IC_{50} = 700 nM）。また、VEGF によって刺激される転写因子 *ets-1* の発現も低下させます。PDGF 受容体（IC_{50} > 50 µM）、EGF 受容体（IC_{50} > 100 µM）、および HER2（IC_{50} > 100 µM）キナーゼに対しては、弱い抑制効果をわずかに示します。漿尿膜（CAM）アッセイおよび *in vivo* VEGF 誘導性透過性アッセイにおける活性から示されるように、血管新生阻害剤として作用します。						
JAK Inhibitor III, SD-1029	118372-34-2	639.3	≥ 80% by HPLC (sum of isomers)	+4℃	DMSO	573098-10MG	33,900
Syk Inhibitor	622387-85-3	353.4	≥ 97% by HPLC (sum of two isomers)	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	574711-5MG	29,900
[3-(1-Methyl-1H-indol-3-yl-methylene)-2-oxo-2,3-dihydro-1H-indole-5-sulfonamide; Spleen Tyrosine Kinase Inhibitor]	細胞透過性のオキシンドール化合物。強力な Syk 阻害剤として作用します（IC_{50} = 14 nM）。ラット好塩基性白血病細胞株 RBL-2H3 において FcεRI を介した脱顆粒を強力に抑制することが明らかになっています（EC_{50} = 313 nM）。						
Syk Inhibitor II	227449-73-2	449.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O（25 mg/ml）or DMSO（100 mg/ml）	574712-1MG	22,900
[2-(2-Aminoethylamino)-4-(3-trifluoromethylanilino)-pyrimidine-5-carboxamide, Dihydrochloride, Dihydrate]	細胞透過性のピリミジン - カルボキサミド化合物。Syk の強力、選択的かつ ATP 競合的な阻害剤として作用し（IC_{50} = 41 nM）、PKC_{α}、$PKC_{\beta II}$、ZAP-70、Btk、および Itk にははるかに高濃度でのみ影響を与えます（IC_{50} = 5.1、11、11.2、15.5、および 22.6 µM）。*in vitro* で RBL-2H3 細胞における $Fc_{\epsilon}RI$ を介した 5-HT 放出を阻害し（IC_{50} = 460 nM）、*in vivo* でマウスにおける受動皮膚アナフィラキシー（PCA）反応を阻害します（ID_{50} = 13.2 mg/kg、s.c.）。						
Syk Inhibitor III	1485-00-3	193.2	≥ 98% by GC	-20℃	DMSO（25 mg/ml）. Use only fresh DMSO.	574713-50MG	25,900
(3,4-Methylenedioxy-β-nitrostyrene)	細胞透過性のニトロスチレン化合物。Syk キナーゼ活性の選択的阻害剤として作用します（IC_{50} = 2.5 µM）。Src は非常に高濃度でのみ阻害し（IC_{50} = 29.3 µM）、Fak および JAK2 に対してはほとんど効果を示しません。U46619、ADP、アラキドン酸、コラーゲン、トロンビン、イオノフォア A23187、PDBu など、さまざまな刺激因子によって誘導される血小板凝集を強力に阻害することが示されています（IC_{50} は 2.1 - 25.9 µM の範囲）。						
Syk Inhibitor IV, BAY 61-3606	732938-37-8	444.9	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（2 mg/ml）or H_2O（20 mg/ml）	574714-2MG	34,000
[BAY 61-3606; 2-(7-(3,4-Dimethoxyphenyl)-imidazo[1,2-c]pyrimidin-5-ylamino)-nicotinamide, 2HCl]	細胞透過性のイミダゾピリミジン化合物。Syk チロシンキナーゼ活性の強力かつ非常に選択的な可逆性 ATP 競合阻害剤として作用し（IC_{50} = 10 nM）、Btk、Fyn、Itk、Lyn および Src に対しては 4.7 µM の高濃度でも抑制効果を示しません。*in vitro* で Syk が媒介する細胞機能を阻害し、ラットモデルにおいて良好な *in vivo* 経口バイオアベイラビリティを示し、さまざまなアレルギーおよび喘息状態の処置に対して効能を発揮することが示されています。						
Syk Inhibitor V		397.5	≥ 99% by HPLC	-20℃	DMSO	574715-2MG	38,900
(-)-Terreic Acid, Synthetic	121-40-4	154.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O（50 mg/ml）	581810-2MG	28,000
[(1R,6S)-3-Hydroxy-4-methyl-7-oxabicyclo[4.1.0]hept-3-ene-2,5-dione]	細胞透過性のキノン - エポキシド抗生物質。Bruton チロシンキナーゼ（BTK）の触媒活性を選択的に阻害します [IC_{50} = 10 µM（基底レベル）、3 µM（活性化レベル）]。BTK プレクストリン相同ドメイン（BTK-PH）に結合して BTK-PH と PKC の間の相互作用を抑制し [IC_{50} 約 100 µM（ヒト肥満細胞溶解物）]、BTK の触媒活性に影響を与えることが明らかになっていますが PKC の活性には影響を与えません。$PKC_{\beta I}$ の自己リン酸化活性を選択的に阻害（IC_{50} 約 8 µM）しますが、$PKC_{\beta II}$ に対しては阻害作用を示しません。FcεRI 刺激肥満細胞において TNF-α の産生（IC_{50} 約 3 µM）および JNK1 の活性化（IC_{50} 約 10 µM）を強力に阻害することが報告されています。また、活性化脾臓細胞における DNA 合成を阻害します（IC_{50} 約 1.5 µM）。Lyn、Syk、PKA、CK-1、ERK1、ERK2、および p38 キナーゼの活性には著しい影響を与えません。						
Tie2 Kinase Inhibitor	948557-43-5	439.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	612085-5MG	47,000
4-(6-Methoxy-2-naphthyl)-2-(4-methylsulfinylphenyl)-5-(4-pyridyl)-1H-imidazole	細胞透過性のピリジニルイミダゾール化合物。Tie2 の強力な可逆的、ATP 競合的阻害剤として作用し（*in vitro* キナーゼアッセイにおける IC_{50} = 250 nM、細胞アッセイにおける IC_{50} = 232 nM）、p38 MAPK に対するより約 200 倍高く VEGFR2、VEGFR3 および PDGFR1b に対するより 10 倍以上高い選択性を示します。マウスにおいて血管新生の Matrigel モデル（50 mg/kg、i.p. b.i.d. で 70% 抑制）と MOPC-315 形質細胞腫異種移植モデルの両方における腫瘍増殖を著しく抑制することが知られています。						
TrkA Inhibitor		315.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（200 mg/ml）	648450-1MG	28,900
	オキシンドール化合物。TrkA に対する強力かつ選択性の高い阻害剤として作用します（IC_{50} = 0.006 µM）。これは、キナーゼの ATP 結合ポケットが標的であるためと考えられています。c-fms、Cdk1、Cdk2、Itk、JNK-3、p38、PDHK4、cRaf1、Src、UL13、および VEGFR2 より 100 倍以上高い選択性を示します。						
AG 9	2826-26-8	184.2	> 98% by TLC	-20℃	Acetic acid, DMSO, or ethanol（10 mg/ml）	658390-5MG	13,000
{[(4-Methoxybenzylidene)malononitrile; α-Cyano-(4-methoxy)cinnamonitrile]; Tyrphostin A1}	EGRF キナーゼの阻害に関するネガティブコントロールとして使用できる不活性化合物（IC_{50} >1250 µM）。ConA 活性化 T 細胞における IL-2 刺激 Tyk-2 リン酸化を阻害することが示されています。						
AG 18	118409-57-7	186.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	Acetic acid, DMSO（10 mg/ml）, or ethanol（50 mg/ml）	658395-5MG	15,900
[α-Cyano-(3,4-dihydroxy)cinnamonitrile; RG-50810; Tyrphostin A23]	スペクトルの広いプロテインチロシンキナーゼ阻害剤。表皮成長因子受容体の自己リン酸化（IC_{50} = 40 µM）およびトランスデューシンの GTPase 活性（IC_{50} = 10 µM）を阻害します。Angiotensin II（製品番号 05-23-0101）に対するアルドステロン分泌応答を阻害します。膵腺房におけるコレシストキニンによる MAP キナーゼ活性化を抑制します。						
AG 82	118409-58-8	202.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）or Methanol（50 mg/ml）	658400-5MG	15,900
[α-Cyano-(3,4,5-trihydroxy)cinnamonitrile; Tyrphostin A25]	プロテインチロシンキナーゼに結合する基質の、細胞膜透過性の競合的阻害剤。表皮成長因子受容体チロシンキナーゼ（IC_{50} = 3 µM）およびトランスデューシンの GTPase 活性（IC_{50} = 7 µM）を阻害します。$p125^{FAK}$（接着斑キナーゼ）のニューロメジン B 誘導性リン酸化を阻害します。グリア細胞における誘導型一酸化窒素合成酵素の誘導を抑制します。ヒト白血病細胞株においてアポトーシスを誘導します。						
AG 490	133550-30-8	294.3	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）	658401-5MG	8,000
[α-Cyano-(3,4-dihydroxy)-N-benzylcinnamide; (*E*)-*N*-benzyl-2-cyano-3-(3,4-dihydroxyphenyl)acrylamide; Tyrphostin B42]	表皮成長因子受容体キナーゼ自己リン酸化の強力な阻害剤（IC_{50} = 100 nM）。AG 490 による JAK2 の阻害は、プログラム細胞死の誘導によって *in vitro* および *in vivo* における白血病細胞増殖を選択的に抑制するものであり、正常な造血機能に有害な影響を及ぼしません。MF 腫瘍細胞の STAT-3 DNA 結合および IL-2 誘導性増殖の恒成性活性化を阻害します。AG 490 は、JAK3 の自己キナーゼ活性を阻害することも示されています。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

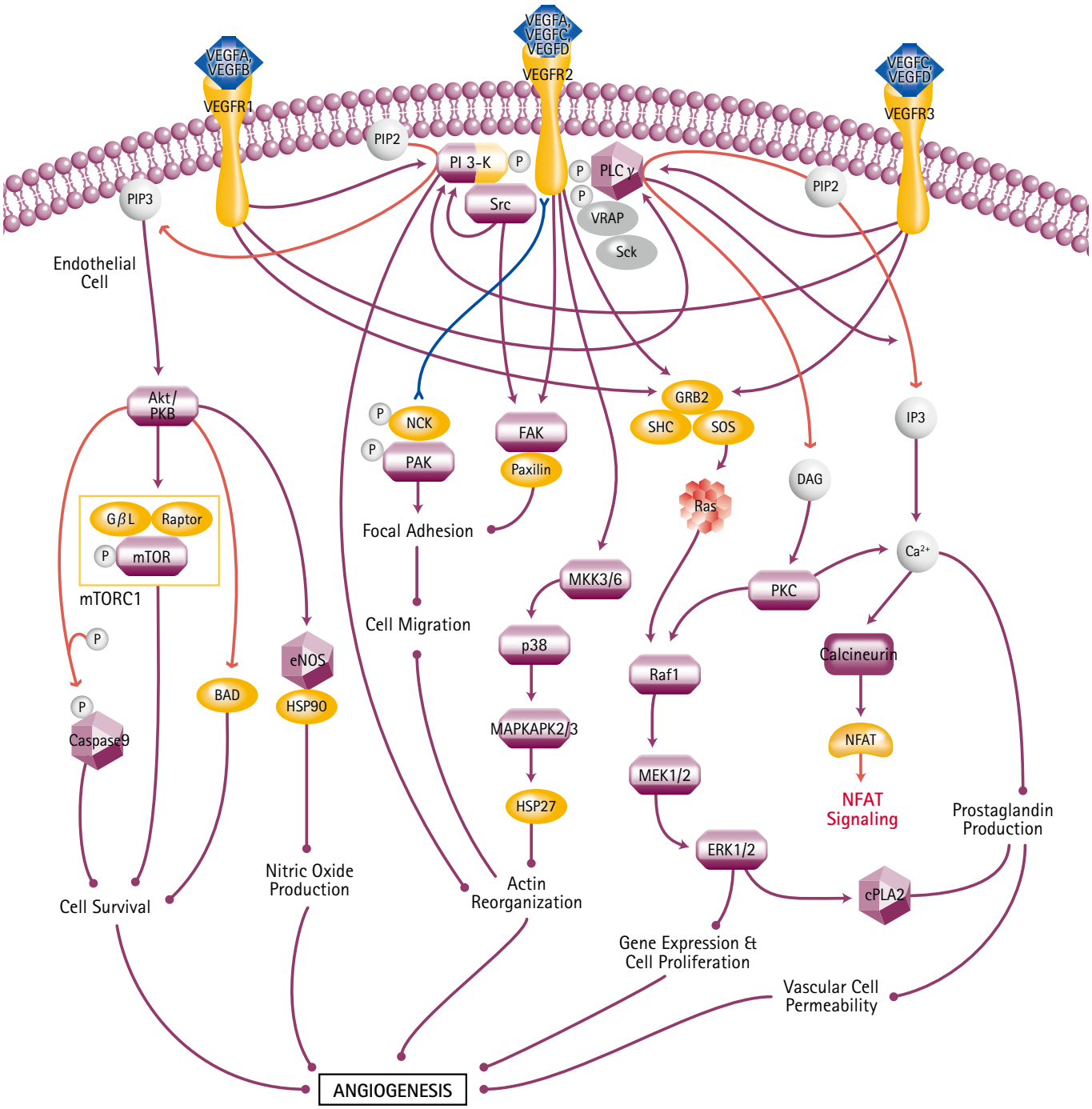
	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
AG 538	**133550-18-2**	**297.3**	**≥ 95% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（5 mg/ml）**	**658403-5MG**	**19,900**
[α-Cyano-(3,4-dihydroxy) cinnamoyl-(3′,4′-dihydroxyphenyl) ketone; Tyrphostin AG 538]	IGF-1R（インスリン様成長因子 -1 受容体）キナーゼ自己リン酸化の強力な競合的阻害剤（IC_{50} = 400 nM）。ATP とは競合しませんが、IGF-1R 基質と競合します。また、IGF-1R、IR、EGR-R、および Src による PTK 基質（Glu、Tyr）のリン酸化も阻害します（IC_{50} = 60 nM、113 nM、370 nM、and 2.4 μM、respectively）。さらに高濃度においては、PKB のリン酸化を阻害します（IC_{50} = 76 μM）。						
AG 490, m-CF3		**362.3**	**≥ 98% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（0.5 mg/ml）or Methanol**	**658408-10MG**	**26,000**
[5H4; α-Cyano-(3,4-dihydroxy)-N-(*m*-trifluoromethyl) benzylcinnamide; NSC D722757]	アポトーシス性と抗増殖性（それぞれ 2E8、Baf/3、Jurkat 細胞で、IC_{50} = 1.7 μM、2.8 μM ならびに 6.1 μM）を示す細胞透過性の、AG 490（製品番号 658401）の *m*- トリフルオロメチル誘導体。2E8 細胞 *in vitro* において IL-7- 誘発性 JAK3 チロシンリン酸化を阻害し、マウスの B および T 細胞リンパ腫モデル（1 mg per 動物、i.p.）*in vivo* のリンパ節細胞質を著しく減らすことが示されています。						
InSolution™ AG490		**294.3**	**≥ 98% by HPLC**	**-70℃**		**658411-5MG**	**10,900**
	Jak ファミリーのチロシンキナーゼ阻害剤。表皮成長因子受容体キナーゼ自己リン酸化を強力に阻害します（IC_{50} = 100 nM）。AG 490 による Jak2 の阻害は、プログラムされた細胞死の誘導によって *in vitro* および *in vivo* における白血病細胞増殖を選択的に抑制し、正常な造血には有害な作用を及ぼしません。MF 腫瘍細胞の STAT-3 および IL-2 誘導増殖の構成的活性化を阻害します。また、AG 490 は JAK3 の自己キナーゼ活性を阻害することが知られています。グアニリルシクラーゼを阻害することも報告されています。						
AG 17	**10537-47-0**	**282.4**	**≥ 99% by TLC**	**-20℃**	**DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）**	**658425-5MG**	**15,900**
[α-Cyano-(3,5-di-*t*-butyl-4-hydroxy) cinnamonitrile; 3,5-di-*t*-Butyl-4-hydroxy-benzylidenemalononitrile; NSC 242557; RG 50872; Tyrphostin A9]	血小板由来成長因子受容体チロシンキナーゼの選択的阻害剤（IC_{50} = 500 nM）として作用する増殖抑制剤。本品は、PYK2 の TNF 誘導性チロシンリン酸化の強力な阻害剤です。NHL 細胞株において、酸化的リン酸化を脱共役し、アポトーシスおよび細胞増殖停止を誘導します。リンパ腫細胞株において Cdk2 活性を阻害します。						
AG 879	**148741-30-4**	**316.5**	**≥ 95% by HPLC**	**-20℃**	**Acetic acid, DMSO, or methanol**	**658460-5MG**	**25,000**
[α-Cyano-(3,5-di-*t*-butyl-4-hydroxy) thiocinnamide]	神経成長因子（NGF）依存性 $p140^{c\text{-}trk}$ チロシンリン酸化（EC_{50} = 10 μM）および NGF 誘導性フォスフォリパーゼ C-γ1 リン酸化を阻害します。また、PC12 細胞における NGF 誘導性神経突起伸展も抑制します。表皮成長因子（EGF）受容体または血小板由来成長因子（PDGF）受容体のチロシンリン酸化には影響を及ぼしません。インスリン分泌を用量依存的に阻害します。						
InSolution™ AG 1478	**175178-82-2**	**315.8**	**≥ 98% by HPLC**	**-20℃**		**658548-1MG**	**15,900**
	DMSO に AG 1478（製品番号 658552）の入った 10 mM（1 mg/317 μl）の溶液						
AG 1295	**71897-07-9**	**234.3**	**≥ 95% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（10 mg/ml）or CH_2Cl_2**	**658550-5MG**	**24,900**
(6,7-Dimethyl-2-phenylquinoxaline)	Swiss/3T3 細胞において、血小板由来成長因子（PDGF）受容体キナーゼ（IC_{50} = 500 nM）および PDGF 依存性 DNA 合成（IC_{50} = 2.5 μM）を選択的に阻害します。EGF 受容体の自己リン酸化には作用を及ぼしません。EGF またはインスリンによって刺激された DNA 合成に対しても弱い作用を示すに過ぎません。平滑筋細胞増殖の強力な抑制剤です。						
AG 1296	**146535-11-7**	**266.3**	**≥ 98% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（10 mg/ml）or acetonitrile**	**658551-5MG**	**25,900**
(6,7-Dimethoxy-3-phenylquinoxaline)	AG 1295（製品番号 658550）に類似していますが、本品のほうが強い活性を示します。PDGF 受容体キナーゼを阻害し、ヒト PDGF の α 受容体（IC_{50} = 1.0 μM）、β 受容体（IC_{50} = 800 nM）および関連する幹細胞因子受容体 c-Kit（80% inhibition at 5 μM）のシグナル伝達を遮断します。PDGF-BB の PDGF-β 受容体への結合および受容体の二量体形成には影響を及ぼしません。ブタ大動脈内皮細胞における VEGF 受容体 KDR の自己リン酸化または血管内皮成長因子によって誘導された DNA 合成にも作用を及ぼしません。また、*sis*- 導入 NIH/3T3 細胞の形質転換された表現型を復帰させますが、*src*- 形質転換 NIH/3T3 細胞またはこれらの細胞から免疫沈降したキナーゼ $p60^{c\text{-}src}$（F257）には作用を及ぼしません。						
AG 1478	**175178-82-2**	**315.8**	**≥ 98% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（5 mg/ml）. Further dilute with aqueous buffers just prior to use.**	**658552-5MG**	**24,000**
[4-(3-Chloroanilino)-6,7-dimethoxyquinazoline]	HER2-neu（IC_{50} >100 μM）および血小板由来成長因子受容体キナーゼ（IC_{50} >100 μM）より表皮成長因子受容体キナーゼ（IC_{50} = 3 nM）に対して極めて強力かつ選択的な阻害作用を示します。Angiotensin II（製品番号 05-23-0101）によって誘導された MAP キナーゼ（ERK）活性を消失させます。また、4- ヒドロキシノネナールによる EGFR キナーゼおよび MAP キナーゼの活性化も阻害します。						
VEGF Receptor 2 Kinase Inhibitor I	**15966-93-5**	**310.4**	**≥ 95% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（1 mg/ml）**	**676480-1MG**	**21,000**
{(Z)-3-[(2,4-Dimethyl-3-(ethoxycarbonyl) pyrrol-5-yl) methylidenyl]indolin-2-one; VEGF Receptor 2 Kinase Inhibitor I}	マウス血管内皮増殖因子受容体 2（VEGF-R2; KDR/Flk-1）に対する、非常に選択的な細胞浸透性の indolin-2-one クラス受容体チロシンキナーゼ（RTK）阻害剤（IC_{50} = 70 nM）。阻害は ATP に関して競合的であることが示唆されています。PDGF、EGF および IGF-1 RTK 活性は、阻害しません（IC_{50} > 100 μM）。						
VEGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor II	**269390-69-4**	**337.8**	**≥ 98% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（5 mg/ml）or methanol**	**676481-5MG**	**36,900**
{N-(4-Chlorophenyl)-2-[(pyridin-4-ylmethyl) amino]benzamide; VEGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor II}	血管新生抑制作用および抗腫瘍作用を示すピリジニル - アントラニルアミド化合物。KDR（IC_{50} = 20 nM）、Flt-1（IC_{50} = 180 nM）および c-Kit（IC_{50} = 240 nM）のキナーゼ活性を強力に阻害します。c-Src（IC_{50} = 7.0 μM）および EGF-R（IC_{50} = 7.3 μM）活性の阻害はごくわずかです。CDK-1、c-Met、IGF-1R および PKA には阻害作用を示しません（IC_{50} > 10 μM）。						
VEGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor IV		**472.9**	**≥ 95% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO（10 mg/ml）**	**676483-500UG**	**33,000**
[N-(2-Chloro-4-((6,7-dimethoxy-4-quinolyl) oxy) phenyl)-N′-(5-methyl-3-isoxazolyl) urea; Vascular Endothelial Growth Factor Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor IV]	細胞透過性のキノリン - 尿素化合物。無胸腺ラットモデル（0.2 mg/kg、p.o.）において抗腫瘍作用および血管新生阻害作用を示します。強力な pan-VEGFR チロシンキナーゼ阻害剤として作用し（VEGFR-1、-2 および -3 に対してそれぞれ IC_{50} = 30 nM、6.5 nM および 15 nM）、EphB2、PDGFR-α、PDGFR-β、c-Kit および Tie-2（それぞれ IC_{50} = 24 nM、40 nM、49 nM、78 nM および 78 nM）に対するより高い選択性を示します。FGFR-1、c-Met、Abl および Src をある程度阻害し（IC_{50} < 1 μM）、FGFR-3、FGFR-4、Flt3、EGFR、ErbB2、IR、Fak、ErbB4、IGF-1R および JAK2 にはほとんど影響を与えません（IC_{50} > 1 μM）。内皮細胞における VEGFR-1、2、3 のリガンド誘導リン酸化を阻害し（IC_{50} = 160-240 pM）、PDGFR-b および c-Kit に対するより 10 倍高い選択性を示す（それぞれ IC_{50} = 1.72 nM および 1.63 nM）ことが明らかになっています。						
VEGFR2 Kinase Inhibitor VI, Ki8751	**228559-41-9**	**469.4**	**≥ 97% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO（46 mg/ml）**	**676484-5MG**	**44,900**
N-(2,4-Difluorophenyl)-N′-(4-(6,7-dimethoxy-4-quinolyloxy)-2-fluorophenyl) urea	細胞透過性のキノリルオキシフェニル尿素化合物。細胞アッセイ（VEGF 誘導受容体リン酸化における IC_{50} = 0.9 nM）および無細胞アッセイ（キナーゼ反応における IC_{50} = 4.0 nM）において VEGFR-2 選択的阻害剤として作用します。はるかに高い濃度でのみ c-Kit、PDGFRα および FGFR-2 を阻害し（細胞アッセイにおける IC_{50} = 40,67 および 170 μM）、8 種類の他の一般的な受容体キナーゼおよび非受容体キナーゼに対しては 10 μM の高濃度でも作用を示しません。VEGF 依存性の（VEGF 非依存性は除く）*in vitro* 細胞増殖ならびに *in vivo* マウスおよびラットにおける腫瘍増殖（5-20 mg/kg、daily p.o.）を強力に抑制します。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Protein Tyrosine Kinase（PTK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
VEGF Receptor 2 Kinase Inhibitor II	288144-20-7	343.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	676485-1MG	27,900
[(*Z*)-5-Bromo-3-(4,5,6,7-tetrahydro-1*H*-indol-2-ylmethylene)-1,3-dihydroindol-2-one; Vascular Endothelial Growth Factor Receptor 2 Kinase Inhibitor II]	Indolin-2-one クラスの膜浸透性受容体チロシンキナーゼ（RTK）阻害剤 [VEGF-R2（KDR/Flk-1）では IC_{50} = 70 nM、PDGF-Rβ では 920 nM、$p60^{c\text{-}src}$ では 4.92 μM、FGF-R1 では 13.3 μM]。阻害は ATP に関して競合的であることが示唆されています。EGF-R キナーゼ活性は阻害しません（IC_{50} > 100 μM）。						
VEGF Receptor 2 Kinase Inhibitor III	204005-46-9	238.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	676487-1MG	32,900
{3-[(2,4-Dimethylpyrrol-5-yl)methylidene]-indolin-2-one; SU5416; Vascular Endothelial Growth Factor Receptor 2 Kinase Inhibitor III}	細胞浸透性 indolinone 化合物。VEGF-R（KDR/Flk-1）および PDGF-R チロシンキナーゼの選択的な ATP 競合的阻害物質として作用します。(Flk-1 を過剰発現した NIH3T3 細胞中では IC_{50} = 1.04 μM および 20.26 μM; ATP に対して K_m = 0.53 μM。)						
VEGF Receptor 2 Kinase Inhibitor IV	216661-57-3	307.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	676489-1MG	21,000
3-(3-Thienyl)-6-(4-methoxyphenyl) pyrazolo[1,5-*a*]pyrimidine	3,6- ジアリル置換ピラゾロピリミジン。VEGFR-2（KDR/Flk-1）に対する強力な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 19 nM）。VEGFR-2 のチロシンキナーゼ活性に対して、PDGFRβ（IC_{50} = 34 nM）より約 2 倍高い選択性を示し、VEGFR-1（Flt-1）および VEGFR-3（Flt-4; IC_{50} = 190 nM）より 10 倍高い選択性を示します。FGFR-1 および Src のキナーゼ活性は阻害しません（IC_{50} > 1.9 μM）。ヒト臍帯静脈内皮細胞において VEGF 刺激による細胞分裂を阻害することが明らかになっています（IC_{50} = 387 nM）。						
VEGF Receptor 3 Kinase Inhibitor, MAZ51		314.1	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	676492-10MG	25,900
[3-(4-Dimethylamino-naphthalen-1-ylmethylene)-1,3-dihydro-indol-2-one; MAZ51; Vascular Endothelial Growth Factor Receptor 3 Kinase Inhibitor]	細胞透過性の 3- 置換インドリン -2- オン化合物。VEGF 受容体チロシンキナーゼの ATP 競合阻害剤として作用します。低濃度（≤ 5 μM）では、PAE 細胞において、VEGF-C（製品番号 676476）および VEGF-D で誘導された VEGFR-3 のリン酸化を特異的に阻害します。VEGFR-2 リン酸化は阻害しません。高濃度（50 μM）でのみ VEGFR-2 リン酸化を部分的に阻害します。この選択的阻害剤は、腫瘍転移などのリンパ管新生依存性病理過程の阻害に有用であると考えられます。						
VEGF Inhibitor, Flt2-11		1273.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）or acetonitrile（20%）	676493-1MG	35,000
（NITVTLKKFPL）	血管内皮細胞増殖因子受容体 -1（VEGFR-1 あるいは FIT-1）の二次 Ig 様ドメインに由来する 11 アミノ酸ペプチドです。ニワトリ漿尿膜の血管新生を阻害することが示されています。また、VEGF の誘導による血管浸透性を阻害します。VEGF への結合も VEGFR への結合阻害も示しません。水溶液中では二量体として存在し安定した β- シート構造をとると言われています。						
VEGF Inhibitor, Je-11		4131.5	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	676494-1MG	73,000
[(RTELNVGIDFNWEYPAS)$_2$K-NH$_2$]	血管内皮増殖因子受容体 2（VEGFR-2 または KDR/Flk-1）の 247-261 番アミノ酸に相当する三次 Ig 様ドメイン由来のペプチドダイマー。VEGF 刺激による VEGFR-2 の自己リン酸化を阻害し、マイクロ新生血管の増殖および移動を阻害します。VEGF に結合し、VEGFR-2 との相互作用をブロックします（細胞外 VEGFR-2 フラグメントに対し IC_{50} = 500 nM、HUVEC 細胞に対し IC_{50}= 30 μM ）。(H-Arg-Thr-Glu-Leu-Asn-Val-Gly-Ile-Asp-Phe-Asn-Trp-Glu-Tyr-Pro-Ala-Ser)$_2$-Lys-NH$_2$						
VEGF Inhibitor, V1		840	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	676495-1MG	28,000
（ATWLPPR）	血管内皮増殖因子受容体 2（VEGFR-2 or KDR/Flk-1）に結合する 8 アミノ酸ペプチドで、VEGF と VEGFR-2 の相互作用を高効率、高親和性で阻害します（IC_{50} = 80 μM）。*in vitro* でヒト内皮細胞の増殖を阻害し、*in vivo* で VEGF による血管新生誘導を阻害します。非内皮細胞の生育には影響を及ぼしません。H-Ala-Thr-Trp-Leu-Pro-Pro-Arg-OH						
VEGF Inhibitor, CBO-P11		1998.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）or H_2O	676496-1MG	63,900
[cyclic(*D*-F-PQIMRIKPHQGQHIGE); Cyclo-VEGI; *D*-Phe-Pro(79-93)]	VEGF の 79-93 番アミノ酸由来の環状 17 アミノ酸ペプチドで VEGFR-2 に結合します。 VEGF165 のそのリセプターへの結合をブロック（IC_{50} = 700 nM for VEGFR1、1.3 μM for VEGFR2）し、血管新生を阻害します。また、VEGFR を介する他の機能も阻害します：細胞増殖（IC_{50} = 5.8 μM）、細胞移動（IC_{50}= 8.2 μM）、および MAP キナーゼ活性化。ヒト頭蓋グリオーマ、先天性グリオーマのモデルとしてのヌードマウス実験およびニワトリ胚での *in vivo* 実験において良好な抗血管新生活性を示します。						
VEGFR2/Flt3/c-Kit Inhibitor	796967-10-7	357.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（40 mg/ml）or Ethanol（10 mg/ml）	676500-5MG	42,000
N-(4-(3-Amino-1H-indazol-4-yl)phenyl)-N′-(3-methylphenyl)urea	細胞透過性の 3- アミノインダゾリルウレア化合物。VEGFR-2、Flt3 および c-Kit の強力な ATP 競合的阻害剤として作用します（IC_{50} = 3 nM、12 nM および 17 nM）。VEGF 誘導 VEGFR-2 リン酸化を抑制し（3T3 マウス線維芽細胞における IC_{50} = 13 nM）、エストラジオール誘導マウス子宮浮腫モデルにおいて経口活性を示します（ED_{50} = 4 mg/kg）。						
VEGFR Tyrosine Kinase Inhibitor V		468.9	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（0.5 mg/ml）or Ethanol（0.2 mg/ml）	676501-5MG	42,000
N-Cyclopropyl-6-(6,7-dimethoxyquinolin-4-yloxy)-1-naphthamide, HCl, VEGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor V	細胞透過性の N- シクロプロピルナフトアミド化合物。VEGFR ファミリーの強力かつ可逆的な ATP 部位ターゲティング阻害剤として作用し（VEGFR2 に対する IC_{50} = 600 pM、VEGFR1 および VEGFR4 に対して同等レベルの阻害）、bFGF（IC_{50} = 170 nM）と比較して VEGF 依存性 HUVEC 増殖を選択的に阻害します（IC_{50} = 910 pM）。43 種類のキナーゼパネルにおいて Lyn、Aurora B、Lck、FGR、Abl、Aurora A、c-Met および Tie-2（IC_{50} = 27 nM、118 nM、330 nM、396 nM、466 nM、2 μM、20 μM および 25 μM）に対するよりかなり高い選択性を示します。VEGF-HEK293 細胞において血管透過性を阻害し、ラット角膜において VEGF 誘導血管新生を阻害する（ED_{50} = 0.01 mg/kg）ことが知られています。						
VEGFR/Tie-2/PDGFR Tyrosine Kinase Inhibitor		445.4	≥ 95% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	676503-5MG	38,900
VEGFR Tyrosine Kinase Inhibitor VI, AAL-993	269390-77-4	371.4	≥ 97% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	676504-10MG	40,000
VEGFR2 Kinase Inhibitor VII, SKLB1002		320.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO	676505-10MG	40,000

VEGF Signaling



タンパク質リン酸化・脱リン酸化

阻害剤関連製品の最新情報はこちらから >> www.merckmillipore.jp/sogaizai

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Raf Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
InSolution™ Raf1 Kinase Inhibitor I		520.9	≥ 97% by HPLC	+4℃		553003-500UG	18,900
	DMSO に Raf1 阻害剤 I（製品番号 553008）の 10 mM（500 µg/96 µl）溶液。						
Raf1 Kinase Inhibitor I	220904-83-6	520.9	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml)	553008-1MG	26,900
{5-Iodo-3-[(3,5-dibromo-4-hydroxyphenyl) methylene]-2-indolinone; GW 5074}	強力な cRAF1 キナーゼ阻害物質（IC_{50} = 9 nM）。Raf キナーゼに対して、CDK1、CDK2、c-Src、ERK2、MEK、p38、Tie2、VEGFR2 および c-Fms の 100 倍以上の選択性を示します。						
Raf Kinase Inhibitor IV	303727-31-3	347.8	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml) or EtOH (10 mg/ml)	553014-1MG	32,000
[2-(Phenyl)-4-(3-hydroxy-4-chlorophenyl)-5-(4-pyridyl)-1H-imidazole]	細胞透過性のトリアリルイミダゾール化合物。B-raf キナーゼの強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し（IC_{50} = 10 nM；K_d = 2.4 nM）、22 キナーゼパネルにおいて p38α、GSK-3β および Lck（それぞれ約 7 倍、30 倍および 70 倍）に対するよりわずかに高い選択性を示します。ERK 活性化を抑制し、B-Raf や MEK1 より Raf-1 や A-Raf に応じて増殖する細胞においてはるかに効率よく成長停止を促進してアポトーシスを誘導することが報告されています。						
Raf Kinase Inhibitor V	918505-84-7	413.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	553015-1MG	22,900
Propane-1-sulfonic acid-(3-(5-chloro-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridine-3-carbonyl)-2,4-difluoro-phenyl)-amide	細胞透過性のアザインドール化合物。Raf キナーゼの ATP 結合部位を作用標的とする強力な可逆的阻害剤として作用し（C-Raf-1Y340D、Y341D、BRafV600E、BRK および B-Raf に対する IC_{50} は 6.7、13、130 および 160 nM）、他のキナーゼ 64 種類（IC_{50} > 1.3 µM）よりもはるかに高い選択性を示します。ERK のリン酸化を阻止し（GI_{50} < 50 nM）、数種の B-RafV600E メラノーマ細胞において細胞周期停止とアポトーシスを誘導します（GI_{50} < 1.7 µM）。さらに、B-RafV600E 依存異種移植マウスモデルにおいて腫瘍増殖を抑制します（20 mg/kg、経口投与）。						
Raf Kinase Inhibitor VI		422.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	553016-5MG	13,000
Rb/Raf-1 Disruptor 251		271.6	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	559270-25MG	19,000

Rho Kinase（ROCK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Hydroxyfasudil	155558-32-0	343.8	≥ 98% by HPLC	-20℃		390602-2MG	25,900
[1-(1-Hydroxy-5-isoquinolinesulfonyl) homopiperazine、HCl; HA1100]	細胞透過性を有する HA 1077（Fasudil；製品番号 371970）の水酸化代謝物。抗狭心症作用を示します。Rho キナーゼに対する可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し（IC_{50} 約 0.9 - 1.8 µM）、MLCK および PKC より約 100 倍高い選択性を示します。*in vitro* と *in vivo* の双方において、収縮の Ca^{2+} 感受性亢進誘導を抑制することが報告されています。						
Rho Kinase Inhibitor		392.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O (5 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	555550-1MG 555550-5MG	37,000 164,000
{H-1152; H-1152P; (S)-(+)-2-Methyl-1-[(4-methyl-5-isoquinolinyl)sulfonyl] homopiperazine, 2HCl; ROCK Inhibitor}	細胞透過性のイソキノリンスルホンアミド化合物。G タンパク質 Rho 関連キナーゼ（ROCK）に対する特異性の高い強力な ATP 競合阻害剤として作用します（K_i= 1.6 nM）。他のセリン / スレオニンキナーゼに対してははるかに低い親和性を示します [K_i= 630 nM（PKA）、9.27 µM（PKC）、10.1 µM（MLCK）]。NT-2 細胞においてミリストイル化アラニンリッチ C キナーゼ基質 MARCKS のリゾフォスファチジン酸誘導性リン酸化を選択的に阻害し（IC_{50} = 2.5 µM）、PDBu 誘導性リン酸化は阻害しないことが明らかになっています。Y-27632（製品番号 688000 および 688001）より強力で選択性が高いことが報告されています。						
Rho-Kinase Inhibitor II		316.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	555551-5MG	36,000
[N-(4-Pyridyl)-N'-(2,4,6-trichlorophenyl) urea]	Rho 関連プロテインキナーゼ（ROCK）に対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用するピリジル尿素化合物（IC_{50} = 0.2 µM）。Erk、PKA、PKC、PDGFR、および c-Kit/SCFR に対してはほとんど作用を示しません（IC_{50} > 10 µM）。						
InSolution™ Rho Kinase Inhibitor		392.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	A 10 mM (500 µg/128 µl) solution of Rho Kinase Inhibitor (Cat. No. 555550) in H_2O.	555552-500UG	25,900
	G- タンパク質 Rho 関連キナーゼ（ROCK; Ki = 1.6 nM）の非常に特異的で有効、ATP 競合的な阻害剤として働く細胞透過性の isoquinolinesulfonamide 化合物。より高い濃度のときにのみ他のセリン／スレオニンキナーゼを阻害します（K_i = 630 nM（PKA）、9.27 mM（PKC）、10.1 mM（MLCK））。NT-2 細胞のミリストイル化アラニンに富んだ C キナーゼ基質 MARCKS（IC_{50} = 2.5 mM）のリゾホスファチジン酸誘発性で PDBu 非誘発性のリン酸化反応を選択的に阻害することが示されています。						
Rho Kinase Inhibitor III, Rockout	7272-84-6	194.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml) or methanol	555553-10MG	23,000
[3-(4-Pyridyl)-1H-indole]	細胞膜透過性のインドロピリジン化合物。Rho キナーゼ活性を選択的かつ ATP 競合的に阻害します（IC_{50} = 25 µM）。Rho キナーゼの活性化は阻害しません。また、MLCK、PKCα、および SAPK2a/p38α の *in vitro* 活性にも影響を与えません。効力が Y-27632（製品番号 688000；IC_{50} 約 5 µM）の約 1/5 であり、H-89 と同様の特異性を示すことが明らかになっています。細胞遊走に影響を及ぼし、blebbing（突起形成）を抑制し [IC_{50} 約 12 µM（M2 細胞）]、50 µM で Bulb 3T3 細胞においてストレスファイバーを減少させます。						
Rho Kinase Inhibitor IV		467.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	555554-1MG	45,000
[H-1152, Glycyl; (S)-(+)-2-Methyl-4-glycyl-1-(4-methylisoquinolinyl-5-sulfonyl) homopiperazine, 2HCl]	Rho-Kinase Inhibitor（製品番号 555550）のグリシルアナログ。ROCK をさらに高い選択性で阻害します（ROCKII、PKA、PKC、PKG、Aurora A および CaMKII に対して、それぞれ IC_{50} = 11.8 nM、> 10 µM、> 10 µM、3.26 µM、2.35 µM および 2.57 µM）。						
Rho Kinase Inhibitor V	1072906-02-5	321.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml) or Ethanol (2 mg/ml)	555555-5MG	35,700
N-(4-(1H-pyrazol-4-yl) phenyl)-2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxine-2-carboxamide	ピラゾリルカルボキサミド化合物。細胞透過性。ROCK- II の強力な ATP 結合ポケット標的阻害剤として作用し（IC_{50} = 1.5 nM）、A7r5 細胞の Thr^{18}/Ser^{19} のミオシン L 鎖 2 ホスホリル化を有効に阻害します（IC_{50} = 72 nM）。高濃度に限り、PKA、MRCK、Akt1（それぞれ IC_{50} = 0.186、1.19 および 1.41 µM）や CYP-450 酵素（10 µM での 2C9/2D6/3A4/1A2 の阻害率（%）= それぞれ 87/40/1/20）の活性にも作用します。						
Rho Kinase Inhibitor VII		388.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	555556-5MG	31,000
ROCK Inhibitor VII	ずっと高い濃度（IC_{50} > 2 µM）のときにのみ一般的に研究されている 24 種類のほかの非 ROCK キナーゼに影響を及ぼし、MCP-1 誘発性 THP-1 細胞移動（IC_{50} = 30 nM）*in vitro* を効果的に阻害する細胞透過性トリアミノトリアジン ROCK 阻害剤（IC_{50} = 6 nM、無細胞 ROCK1 キナーゼアッセイ）。ROCK 阻害剤 VII の皮下注射（3-10 mg/kg）ならびに Y-27632（Cat. Nos. 688000 & 688001）の経口投与は両方とも、高血圧自然発生ラットモデル *in vivo* の動脈圧を著しく下げることが報告されています。						
Rho/SRF Pathway Inhibitor, CCG-1423	285986-88-1	454.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	555558-25MG	26,900
N-(2-(4-Chloroanilino)-1-methyl-2-oxoethoxy)-3,5-bis(trifluoromethyl) benzamide	細胞透過性のベンズアミド化合物。Ga12/13 および RhoA/C の下流の情報伝達イベントのターゲティングを行い、MKL の動員および / または MKL1 の動員後の機能に影響を及ぼす一方、SRF-SRE 相互作用や ROCK キナーゼ活性には影響しないことにより、RhoA および RhoC を介した細胞活性の効果的な阻害剤として作用します。A375M2 および SK-Mel-147 における RhoC 依存性細胞増殖を阻害し（IC_{50} ≤ 300 nM）、Matrigel アッセイにおいて RhoC/Ga12 を介した PC-3 細胞の浸潤を阻止することが判明しています（濃度 3 µM において約 90%）。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

Rho Kinase（ROCK）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Y-27632	146986-50-7	338.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O（100 mg/ml）	688000-1MG	28,000
						688000-5MG	98,000
						688000-10MG	120,000
[(R)-(+)-*trans*-N-(4-Pyridyl)-4-(1-aminoethyl)-cyclohexanecarboxamide, 2HCl; ROCK Inhibitor]	非常に強力かつ選択的な Rho 結合タンパク質キナーゼの細胞浸透性阻害剤（p160ROCK については K_i= 140 nM）。PKC, については、p160ROCK よりも 10 から 50 倍低いアフィニティーを示します。別の Rho ファミリー GTP アーゼである Cdc42 によって活性化されるタンパク質キナーゼ、PKA の活性には有意な影響を及ぼしません。						
InSolution™ Y-27632		338.3	≥ 95% by HPLC	-20℃		688001-500UG	19,000
	H_2O に Y-27632（製品番号 688000）の 5 mM（500 µg/296 µl）溶液。						
InSolution Y-27632 in DMSO		338.3	≥ 95% by HPLC	-70℃		688002-1MG	39,900

RNA-Dependant Protein Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
PKR Inhibitor	608512-97-6	268.3	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	527450-5MG	23,000
（RNA-Dependent Protein Kinase Inhibitor）	強力で ATP 結合部位特異的な PKR 阻害剤として作用するイミダゾロ - オキシンドール化合物。強力な RNA 誘導性 PKR 自己リン酸化の阻害作用（IC_{50} = 210 nM）および PKR 依存性翻訳抑制の解除作用（IC_{50} = 100 nM）を示すことが確認されています。ネガティブコントロール（製品番号 527455）もあります。						
PKR Inhibitor, Negative Control	852547-30-9	340.6	≥ 95% by HPLC (sum of two isomers)	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（10 mg/ml）	527455-10MG	26,900
[5-Chloro-3-(3,5-dichloro-4-hydroxybenzylidene)-1,3-dihydro-indol-2-one; RNA-Dependent Protein Kinase Inhibitor, Negative Control]	PKR Inhibitor（製品番号 527450）のネガティブコントロールとして使用するオキシンドール化合物。RNA 誘導性 PKR 自己リン酸化の阻害作用（IC_{50} > 100 µM）および PKR 依存性翻訳抑制の解除作用を示さないことが確認されています。						

SHIP 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
SHIP2 Inhibitor		387.7	≥ 98% by 1H NMR	+4℃	EtOH	565835-10MG	33,000
SHIP2 Inhibitor, 3AC		428.3	≥ 99% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	565840-10MG	38,900

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

STAT 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Cryptotanshinone	35825-57-1	296.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	233630-10MG	28,000
STAT3 Inhibitor XVI		446.08	≥ 98% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	407625-5MG	38,900
Nifuroxazide	965-52-6	275.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	481984-500MG	17,900
5-Nitro-2-furaldehyde-p-hydroxybenzoylhydrazone	293 細胞における TNF-α 誘発性 NF-κB 活性化に対してほとんど影響を及ぼさない一方、細胞 STAT1/3/5 転写活性（IC_{50} = 3 μM、U3A 細胞の IL-6 誘発性 STAT3 活性化に対し）の活性化を効果的に抑制する細胞透過性の経口投与可能なニトロフランベースの下痢止め薬。Akt/EGFR/JAK1/MAPK/Src や STAT3 の Ser727 リン酸化は阻害せずに、JAK2/TYK2/STAT3（IC_{50} = 10 μM、U266 細胞における STAT3 の tyr705 に対し）の細胞チロシンのリン酸化を阻害することを示しています。						
STAT3 Inhibitor Peptide		870.9	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O	573095-1MG	35,000
STAT3 Inhibitor Peptide, Cell-Permeable		1958.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O	573096-1MG 573096-5MG	39,900 98,000
STAT3 Inhibitor III, WP1066	857064-38-1	356.2	≥ 97% by HPLC	-20℃		573129-5MG	28,900
STAT3 Inhibitor III, WP1066	857064-38-1	356.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	573097-10MG	32,900
STAT3 Inhibitor V, Stattic	19983-44-9	211.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	573099-25MG	42,900
(6-Nitrobenzo[b]thiophene-1,1-dioxide; *Statt*hree *i*nhibitoryc ompound)	細胞透過性のビニルスルホン化合物。STAT3-SH2 ドメインに結合し、STAT3 pTyr705 を抑制します（IC_{50} = 5.1 μM）。JAK1、JAK2 および c-Src キナーゼには影響を与えません。また、STAT3 に依存的な乳がん細胞でアポトーシスを誘導します。STAT3 の活性化、2 量体化および核内移行の不可逆的阻害剤として作用し、STAT1、STAT5、c-Myc/Max および Jun/Jun には選択性を示します。						
STAT3 Inhibitor VI, S3I-201	501919-59-1	365.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）. Use only fresh, anhydrous DMSO.	573102-10MG	33,900
[2-Hydroxy-4-(((4-methylphenyl)sulfonyloxy) acetyl)amino)-benzoic acid; NSC 74859]	細胞透過性のアミドサリチル酸化合物。Stat3-SH2 ドメインに選択的に結合し、Stat3 活性化を抑制します。Stat3 2 量体化および DNA 結合転写活性を抑制し（IC_{50} = 86 μM）、サイクリン D1、Bcl-xL および survivin の発現レベルを低下させることが示されています。Stat3 活性腫瘍細胞において細胞増殖を停止させてアポトーシスを誘導し、異種移植マウスモデルにおいて抗腫瘍作用を示します（5 mg/kg、*i.v.*）。						
InSolution™ STAT3 Inhibitor VI, S3I-201		365.4	≥ 95% by HPLC	-20℃		573130-5MG	25,000
STAT3 Inhibitor VII	1041438-68-9	444.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	573103-5MG	32,900
Ethyl-1-(4-cyano-2,3,5,6-tetrafluorophenyl) -6,7,8-trifluoro-4-oxo-1,4-dihydroquinoline-3-carboxylate	細胞透過性を有するジヒドロキノリン化合物。U266 細胞（EC_{50} =170 nM）ならびに IFN-α 刺激 HeLa 細胞および DU145 細胞において P-STAT3-Y705 を強力に阻害します。さらに、IFN-α 刺激 U266 細胞で P-JAK1-Y1022/1023、P-JAK2-Y1007/1008 および P-Tyk2-Y1054/1055 を阻害します。P-STAT3-S727 または P-STAT5-Y694/699 には作用せず、JAK1、JAK2 または JAK3（10 μM 以下）あるいは PKC の *in vitro* キナーゼ活性を阻害しません。サイクリン D1（CCND1）、骨髄細胞白血病配列（MCL1）および Bcl2 様 1（BCL2L1）などの数種の STAT3 標的遺伝子をダウンレギュレートし、アポトーシスを誘導するとともに、Akt-mTOR 経路および MAPK 経路よりも STAT3 シグナリングに対する選択性を示すことが認められています。						
STAT3 Inhibitor Peptide, Cell-permeable, Inactive Control		1878.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	H_2O（1 mg/ml）	573105-5MG	66,900
NH_2-PYLKTKAAVLLPVLLAAP-CO_2H	STAT3 Inhibitor（製品番号 573096）の細胞透過性の非リン酸化アナログ。1 mM までの濃度で Stat3 活性化に影響を与えません。						
STAT3 Inhibitor IX, HJB		346.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	573106-1MG	17,000
STAT3 Inhibitor VIII, 5,15-DPP	22112-89-6	462.5	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（<1 mg/ml）	573109-25MG	21,900
5,15-Diphenylporphyrin	細胞透過性のポルフィリン化合物。STAT3 に直接結合します。STAT3 の二量体化を阻害（IC_{50}=0.28 μM）して STAT3-SH2 ドメインのアンタゴニストとして作用し、STAT1 および Grb2 よりも高い選択性を示します（IC_{50} はそれぞれ 10、> 20 μM）。MDA-MB-468 細胞における STAT3 の核移行とその後の DNA 結合を優先的に抑制しますが、STAT1、STAT5a および STAT5b には影響を及ぼしません。さらに、IL-6 による誘導を受けた HEK-293-STAT3 細胞において、cmyc プロモーター結合および c-myc タンパク質発現を低下させます。JAK キナーゼ活性には影響せず、STAT3 の発現やリン酸化レベルも低下させません。						
STAT3 Inhibitor IX, Cpd188	823828-18-8	433.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	573125-10MG	18,900
STAT5 Inhibitor	285986-31-4	293.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	573108-10MG	22,900
N'-((4-Oxo-4H-chromen-3-yl)methylene) nicotinohydrazide	細胞透過性のニコチノイルヒドラゾン化合物。STAT3、STAT1 および Lck（IC_{50} > 500 μM）より STAT5b（IC_{50} = 47 μM）の SH2 ドメインの機能を選択的に阻害します。IFN-α 刺激 Daudi 細胞において STAT5 チロシンリン酸化を抑制し、K562 細胞において Jun/Fos/DNA にはほとんど作用を示さずに TAT/STAT5/DNA レベルを低下させることが知られています。						
STAT5 Inhibitor II, IQDMA		304.39	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	420294-10MG	17,000
Ursolic Acid		456.7	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）or Ethanol（3.5 mg/ml）	672315-50MG	13,000
	抗炎症、免疫調節、抗腫瘍活性を示す抗炎症、免疫調節、抗腫瘍活性を示す細胞透過性の植物由来の 5 環性トリテルペン酸。ホスフォターゼ阻害活性の IR 自己リン酸化非依存を誘発し、SHP2、PTP1B、TCPTP（IC_{50} = それぞれ 2.73、3.08 ならびに 3.33 μM）のホスフォターゼ活性を阻害することを示しています。ウルソル酸は癌培養の NF-κB ならびに STAT3 経路活性を阻害することと、結果として化学療法薬剤とアポトーシス細胞死に対する感受性が増大することが報告されています。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

TGF-β Receptor Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
BMP Inhibitor II, DMH1	1206711-16-1	380.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	203646-5MG	31,900
IM-412		343.77	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO (3 mg/ml)	401251-10MG	24,900
3-(2-chlorobenzyl)-1,7-dimethyl-1H-imidazo[2,1-f]purine-2,4(3H,8H)-dione,	細胞毒性がなく IC_{50} が 4.1 μM のとき、HEK293 レポーター細胞において用量依存的に TGF-β 刺激レポーター活性を減らす細胞透過性 imidazoxanthine。JNK ならびに ERK 活性や、TGF-β 受容体 I (TβRI) ならびに TGF-β 受容体 II (TβRII) 発現、ダウンストリーム Smad2 ならびに Smad3 リン酸化反応を阻害します。さらに、α-SMA やフィブロネクチンなどの複数の線維性マーカーの発現が弱まり、TGF-β 誘発性線維芽細胞の分化を引き起こし、CCD-18Lu 正常ヒト肺線維芽細胞のコラーゲン蓄積を抑制します。						
Smad3 Inhibitor, SIS3		453.5	≥ 93% by HPLC	+4℃	DMSO (15 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	566405-1MG	27,000
[6,7-Dimethyl-2-((2E)-3-(1-methyl-2-phenyl-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-3-yl-prop-2-enoyl))-1,2,3,4-tetrahydroisoquinoline; SIS3; Specific Inhibitor of Smad3]	細胞透過性のピロロピリジン化合物。TGF-β1 に依存的な Smad3 のリン酸化と Smad3 が媒介する細胞のシグナル伝達を選択的に阻害し、Smad2、p38 MAPK、ERK または PI 3-K のシグナル伝達には影響を与えません。						
TGF-β RI Kinase Inhibitor	396129-53-6	272.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	616451-5MG	14,000
{ALK5 Inhibitor I; [3-(Pyridin-2-yl)-4-(4-quinonyl)]-1H-pyrazole; TβR-I Inhibitor; Transforming Growth Factor-β Type I Receptor Kinase Inhibitor}	細胞透過性の２ヘテロアリル置換ピラゾール化合物で、強力で選択的な、ATP 競合的な TGF-β RI キロシンキナーゼ阻害剤 (IC_{50} = 51 nM)。p38a MAP キナーゼに対して (IC_{50} = 740 nM) よりも約 15 倍選択的に作用します。TGF-β 依存性の細胞増殖を阻害し (IC_{50} = 89 nM in NIH 3T3 mouse fibroblasts)、転写活性化を抑制します (IC_{50} = 47 nM in mink lung cells)。						
TGF-β RI Kinase Inhibitor II	446859-33-2	287.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	616452-2MG	24,900
[ALK5 Inhibitor II; 2-(3-(6-Methylpyridin-2-yl)-1H-pyrazol-4-yl)-1,5-naphthyridine; Transforming Growth Factor-β Type I Receptor Kinase Inhibitor II]	細胞透過性のナフチリジニル - ピラゾロ化合物。TGF-β I 型受容体 (ALK5) に対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します [IC_{50} = 23 nM (ALK5 結合)、4 nM (ALK5 自己リン酸化)、18 nM (HepG2 細胞を用いた TGF-β 細胞アッセイ)]。p38 MAPK を含む関連性の高い 9 種類のキナーゼにはほとんど作用を示しません (IC_{50} > 16 μM)。						
TGF-β RI Inhibitor III	356559-13-2	371.9	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml) or H_2O (3 mg/ml)	616453-2MG	36,900
[2-(5-Benzo[1,3]dioxol-4-yl-2-*tert*-butyl-1H-imidazol-4-yl)-6-methylpyridine, HCl; Transforming Growth Factor-β Type I Receptor Kinase Inhibitor III]	細胞透過性のイミダゾリルピリジン化合物。アクチビン受容体様キナーゼ 4 (IC_{50} = 129 nM)、5 (IC_{50} = 47 nM) および 7 の強力かつ選択的な可逆性 ATP 競合阻害剤として作用します。p38 MAPKα は非常に高濃度でのみ阻害し (IC_{50} = 10.6 μM)、ALK1/2/3/6 および他の 26 種類のキナーゼ群に対してはほとんど効果を示しません。						
TGF-β RI Inhibitor IV	909910-43-6	421.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml)	616454-2MG	33,900
[A-83-01; 3-(6-Methylpyridin-2-yl)-4-(4-quinolyl)-1-phenylthiocarbamoyl-1H-pyrazole; Transforming Growth Factor-β Type I Receptor Kinase Inhibitor IV]	細胞透過性の三置換ピラゾールで、TGF-β 誘導の ALK-4, -5, -7 のシグナリング (感染 Mv1Lu R4-2 細胞で、IC_{50} = 45 nM 、12 nM、7.5 nM) を強力に阻害します。 HaCaT 細胞の Smad2 のリン酸化、NMuMG 細胞の EMT (上皮から間葉への移行) の両方を 1 μM で完全に阻害しますが、ALK-1, -2, -3, -6 および MAPK パスウェイの活性は 10 μM でも影響は弱いです。更に、SB-431542 よりも選択的に強力に阻害を示します。						
TGF-β RI Inhibitor V	627536-09-8	352.8	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	616456-2MG	28,000
[2-(5-Chloro-2-fluorophenyl)pteridin-4-yl)pyridin-4-yl amine; SD-208; Transforming Growth Factor-β Type I Receptor Kinase Inhibitor V]	細胞透過性のプテリジン化合物。TGF-β シグナル伝達を遮断し、抗腫瘍作用を示します。TGF-β RI キナーゼの強力かつ選択的な可逆的阻害剤として作用します (ALK5 および突然変異体 *Drosophila* p38a に対してそれぞれ EC_{50} = 48 nM および 867 nM)。5 μM で MAPKAP2 (87%)、PKD (70%) および EGFR (68%) の活性を阻害し、TGF-β RII、p38γ、JNK、ERK2、MAPKK6、PKA および PKC にはほとんど作用を示しません (EC_{50} > 50 μM)。β-カテニン、Smad2/3 および HIF-1α の核移行を阻害することによって IL-6 および VEGF の産生を抑制することが報告されています。						
TGF-β RI Kinase Inhibitor VII	666729-57-3	351.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (2 mg/ml)	616458-5MG	35,900
1-(2-((6,7-Dimethoxy-4-quinolyl)oxy)-(4,5-dimethylphenyl)-1-ethanone	細胞透過性のキノリン化合物。TGF-β Receptor I Kinase (ALK5) の可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し (ALK5 および Smad2/3 レポーターアッセイにおける IC_{50} = 0.63 μM および 0.37 μM)、c-Src キナーゼ (IC_{50} = 13 μM) に対するより高い選択性を示します。TGF-β 誘導性の Smad-2 リン酸化を IC_{50} =0.5 μM で抑制することが知られています。						
TGF-β RI Kinase Inhibitor VIII	356559-20-1	343.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	616459-2MG	22,900
SB-525334	細胞透過性で経口投与可能なキノキサリン化合物。TGF-β RI/ALK5 の強力な ATP 競合的・可逆的阻害剤として作用し (IC_{50} = 14.3 nM)、ALK4 (IC_{50} =58.5 nM)、p38a (IC_{50} = 1.5 μM) や他の関連キナーゼ 26 種 (ALK2,3 および 6 を含む) (IC_{50} > 10 μM) よりも強い選択性を示します。TGF-β1 により誘導される Smad2/3 のリン酸化と核移行を阻害し、A498 腎細胞においてプラスミノーゲン活性化因子インヒビター 1 (PAI-1) とプロコラーゲン a1 の発現量を低下させる (IC_{50} はそれぞれ 103 および 33.6 nM) ことに加え、ラット腎疾患モデルにおいても両者の発現量を低下させることが報告されています (10 mg/kg、経口投与)。						
TGF-β RI Kinase Inhibitor VI、SB431542	301836-41-9	420.42	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or Ethanol (10 mg/ml)	616461-5MG	17,900
SB-431542	活性 ALK1,2,3,6 を発現する NIH 3T3 培養における TGF-β 用 1 型受容体のほかのメンバーによる Smad1 リン酸化反応に対してほとんど効果が無いことを示す一方、NIH 3T3 細胞の構造的な活性 ALK4、ALK5、or ALK7 のベクター介在発現時に細胞 Smad2 リン酸化反応 (>90% inhibition by 10 μM inhibitor) を効果的に阻害することが示されている細胞透過性トリアリールイミダゾール化合物。無細胞のキナーゼアッセイにおいて直接試験したとき、SB431542 は、ALK2 と ALK6 を含む 23 種類のキナーゼのパネルに対して有効性が低下することがほとんど、あるいは全くなく、ALK4 ならびに ALK5 (IC_{50} = 140 nM and 94 nM、respectively) の活性を有効に阻害することが示されました。PD0325901 (製品番号 444966) ならびにチアゾビビン (製品番号 420220) を同時に用いたとき、線維芽細胞培養からの 4-TF- 誘発性ヒト iPSCs の生成の効率が向上することが報告されています。						
TGF-β RI Kinase Inhibitor IX		370.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	616463-10MG	32,900
4-((4-((2,6-Dimethylpyridin-3-yl)oxy)pyridin-2-yl)amino)benzenesulfonamide	75 種類の他のキナーゼ (IC_{50} <1 μM) のパネルに対しては活性がかなり小さい、またはほとんどない一方、ATP 結合部位ならびに " 選択的ポケット " の両方を標的として "TGFβ RI/ALK5 (IC_{50} = 72 nM、[ATP] = 1 mM) に対して有効で高い選択性の阻害剤として働く細胞透過性 pyridinyloxypyridine 化合物。MDA-MB-468 細胞 (IC_{50} = 22 nM) *in vitro* における GFP-Smad2 融合レポーターの TGFβ1-I 誘発性核転座を減らし、ラット *in vivo* におけるクリアランスが低く (12 ml/min/kg) 素晴らしい経口バイオアベイラビリティ (F = 75%、AUC = 4.95 μM.h) が示されています。						
InSolution™ TGF-β RI Kinase Inhibitor VI, SB431542	301836-41-9	420.4	≥ 97% by HPLC	-20℃		616464-5MG	24,900

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

プロテインホスファターゼ 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
bpV(bipy)		380.3	≥ 95% by ^{51}V-NMR	-20℃	H_2O (5 mg/ml)	203694-5MG	30,900
[Potassium Bisperoxo(bipyridine)oxovanadate (V)]	フォスフォチロシンフォスファターゼの強力な阻害剤（インシュリン受容体リン酸化に対しての K_i= 100 nM)。インスリン受容体キナーゼ（IRK）の活性化因子です。						
bpV(phen)	42494-73-5	404.3	≥ 99% by ^{51}V-NMR	-20℃	H_2O (5 mg/ml)	203695-10MG	35,900
[Potassium Bisperoxo(1,10-phenanthroline) oxovanadate (V)]	強力なタンパク質フォスフォチロシンフォスファターゼ阻害剤であり、インスリン受容体キナーゼ（IRK）の活性化因子です。*in vitro* および *in vivo*（15 μg/kg）において、優れたインスリン様作用を示します。自己リン酸化インスリン受容体の *in situ* 脱リン酸化を、オルトバナジン酸ナトリウムの 1,000 倍を上回る効力で阻害します。神経芽腫細胞 NB 41 および神経膠腫細胞 C6 の増殖を、細胞周期の G_2/M 移行期で停止させます。						
bpV(HOpic)		419.3	≥ 90% by ^{51}V-NMR	-20℃	H_2O (4 mg/ml)	203701-5MG	31,900
[Dipotassium Bisperoxo(5-hydroxypyridine-2-carboxyl)oxovanadate (V)]	強力なフォスフォチロシンフォスファターゼ阻害剤。肝がん細胞のインスリン受容体キナーゼ（IRK）を活性化します。また、単離脂肪細胞における脂質生成を促進します。						
Calcineurin Autoinhibitory Peptide		2930.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O	207000-250UG	27,000
(ITSFEEAKGLDRINERMPPRRDAMP)	カルシニューリン（PP2B）のカルモジュリン結合ドメインの C 末端ドメイン（アミノ酸残基 457-482 番）に対応するペプチド。カルシニューリン特異的阻害剤です。CaM キナーゼ II、プロテインフォスファターゼ 1 または 2A に対する阻害作用は示しません。Mn^{2+} 刺激カルモジュリン活性を阻害します（IC_{50} = 10 μM ^{32}P-myosin 軽鎖を基質として使用した時）が、Ni^{2+} 刺激による酵素活性には作用を及ぼしません。						
Calcineurin Autoinhibitory Peptide, Cell-permeable		3501.1	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	207001-1MG	45,000
(11R-CaN-AID; Ac-RRRRRRRRRRRGGGRMAPPRRDAMPSDA-NH_2)	ポリアルギニン系タンパク質形質導入ドメイン（11R）を融合させたカルシニューリン（CaN）自己抑制ドメイン（AID）から成る細胞透過性ペプチド。CaN フォスファターゼ活性の阻害剤として作用します。神経細胞における CaN 依存的 NFAT 核輸送および NFAT プロモーター活性をブロックします。グルタミン酸誘導性の細胞死から神経細胞を保護します。						
Calcineurin Inhibitor VIII, CN585	1213234-31-1	404.4		-20℃	DMSO (10 mg/ml)	207003-10MG	21,000
6-(3,4-Dichlorophenyl)-4-(N,N-dimethylaminoethylthio)-2-phenyl-pyrimidine	細胞透過性のピリミジン化合物。pNPP（製品番号 4876、487600、487655、487663、487666）を除き、RII ホスホペプチド（製品番号 207008）のカルシニューリン（PP2B）触媒脱リン酸化をカルモジュリン非依存的かつ基質非競合的に可逆的に阻害することが示されていますが（IC_{50} = 3.5 μM; K_i= 3.8 μM)、100 μM の高濃度でも PP1、PP2A または PP2C に対する活性はほとんどありません。CsA（製品番号 239835）および FK506（製品番号 342500）と異なり、PP2B の阻害に CypA（製品番号 239777）および FKBP ファミリーのイムノフィリンを必要とせず、Cyp18、FKBP12（製品番号 325902）および Pin1 のペプチジルプロリル *cis/trans* イソメラーゼ（PPIase）活性を阻害しません。しかし、結合試験から CN585 と Cyp18/CsA では、PP2B の触媒サブユニットの標的部位が共通または重複することが分かっています。濃度 30 μM で、HeLa 細胞の NFAT 核転移、Jurkat 細胞の NFAT 転写活性（IC_{50} = 10 μM）のほか、PMA/ イオノマイシン刺激による PBMC の IL-2 産生（IC_{50} = 13 μM）を有効に阻止することが示されています。						
CaMKP Inhibitor	52789-62-5	377.3	≥ 85% by Titration	+4℃	H_2O (1 mg/ml)	208775-100MG	22,000
1-Amino-8-naphthol-2,4-disulfonic acid	Ca^{2+}/ カルモジュリン依存性プロテインキナーゼフォスファターゼ（CaMKP）およびその核アイソフォーム CaMKP-N（それぞれ IC_{50} = 6.4 μM、6.6 μM）の基質競合的阻害剤として作用するアミノナフトールスルホン酸です。PP2B/CaN および PP2C に対してはほとんど作用を示しません（10 μM で <10% 阻害）。						
Calyculin A, Discodermia calyx	101932-71-2	1009.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO or Ethanol (2 mg/ml)	208851-10UG	15,900
	プロテインフォスファターゼ 2A（PP2A; IC_{50} = 0.5-1.0 nM）およびプロテインフォスファターゼ 1（PP1; IC_{50} = 2 nM）の細胞膜透過性阻害剤。酸化的 DNA 損傷を誘発する、非ホルボールエステル型腫瘍促進因子です。興奮性シナプスにおいて、AMPA 受容体を介したシナプス伝達の効率を選択的に上昇させます。また、バーキットリンパ腫細胞株 BM13674 においてγ線照射誘導性アポトーシスを抑制することも知られています。						
Cantharidic Acid	28874-45-5	214.2	> 95% by TLC	room temp.	DMSO (25 mg/ml) or warm Ethanol (10 mg/ml)	210150-10MG	18,900
(5'-3'2,3-Dicarboxy-2,3-dimethyl-1,4-epoxycyclohexane; *exo*-1,6-Dicarboxy-*endo*-1,6-dimethyl-7-oxabicylco[2,2,1]heptane)	プロテインフォスファターゼ 2A の強力な阻害剤（IC_{50} = 50 nM)。						
CDC25 Phosphatase Inhibitor I, BN82002		359.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (10 mg/ml)	217691-5MG	25,000
[N-(2-Hydroxy-3-methoxy-5-dimethylamino) benzyl, N'-(2-(4-nitrophenethyl)), N''-methylamine]	抗腫瘍性を示す細胞透過性のオルト - ヒドロキシベンジルアミノ化合物。CDC25 フォスファターゼファミリーの強力な選択的、不可逆的阻害剤として作用（25A、25B2、25B3、25C および 25C-cat に関して、それぞれ IC_{50} = 2.4、3.9、6.3、5.4 および 4.6 μM)。CD45 チロシンフォスファターゼに対するよりも、約 20 倍高い選択性を示します。*in vitro* で細胞周期の進行を遅らせ（7.2-32.6 μM の範囲の IC_{50})、ヒト膵細胞 MIA PaCa-2（15 mg/kg、i.p. 経路）を異種移植した無胸腺症マウスにおける腫瘍の増殖を低下させることが示されています。						
CDC25 Phosphatase Inhibitor II, NSC 663284	383907-43-5	321.8	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml) Use only fresh, anhydrous DMSO.	217692-5MG	39,000
[6-Chloro-7-(2-morpholin-4-yl-ethylamino) quinoline-5,8-dione; DA3003-1]	抗増殖性を示す細胞透過性の 7 置換キノリンジオン化合物。CDC25 フォスファターゼファミリーの強力な不可逆的、混合的競合阻害剤として作用（CDC25A、CDC25B2 および CDC25C に対して、それぞれ K_i= 29 nM、95 nM および 89 nM; CDC25B2 に対して IC_{50} = 210 nM)。VHR および PTP1B に対するより、ほぼ 20 倍および 450 倍高い選択性を示します（それぞれ、IC_{50} = 4.0 μM および > 100 μM)。細胞周期の進行を停止させ、Cdks 脱リン酸化を阻害し、腫瘍増殖を遅らせることが報告されています（NCI-60 腫瘍細胞パネルにおける平均 IC_{50} = 1.5 μM)。CDC25A の触媒ドメインを改変し、HeLa-CDC25A 細胞における細胞性 ERK の脱リン酸化を妨げることが示されています。						
CEP-701	111358-88-4	478.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) or Ethanol (1 mg/ml)	219499-5MG	39,900
KT-5555	細胞透過性のインドロカルバゾールアナログ。JAK2、JAK3、Flt3、および pan Trk の強力かつ可逆的な ATP 競合的阻害剤として作用し（IC_{50} はそれぞれ 0.9、3,3、および 3.7 nM)、VEGFR2、PKC、および PDGFRβ（IC_{50} はそれぞれ 65,218、および 773 nM）と比較して比較的弱い選択性を示すとともに、濃度 1 μM において EGFR、IR、FMS、KIT、および Bcr-Abl 活性にはほとんど影響せず、抗腫瘍活性を示します。BaF3/ITD および Flt3-BaF3D835Y/H 細胞における Flt3（IC_{50} < 5 nM)、HEL92.1.7 細胞における JAK2V617F（IC_{50} ≤ 30 nM)、および TT 細胞における RET（IC_{50} は約 50 nM）のリン酸化を阻害し、下流における STAT5、STAT3、および ERK1/2 シグナル伝達の活性化を顕著に阻害します。32D/pBabe および 32D/Flt3/ITD の分化を誘導し、マウスにおけるヒト PDAC（膵管腺癌）由来の異種移植片数種の細胞周期停止とアポトーシスを引き起こすとともに、腫瘍の増殖と浸潤を抑制します（10 mg/kg、皮下投与)。						
Cyclosporin A, *Tolypocladium inflatum*	59865-13-3	1202.6	≥ 97% (dry basis)	+4℃	DMSO (25 mg/ml), Ethanol, Methanol, or chloroform	239835-100MG	17,000
	免疫抑制作用を有する環状オリゴペプチド。ラット胸腺細胞およびマウス B 細胞リンパ腫細胞株 WEH1-231 においてアポトーシスを誘導します。しかし、BLB 細胞株においては、抗 IgM 抗体およびイオノマイシンによって誘導されるアポトーシスを抑制します。シクロスポリン A とシクロフィリンの複合体は、nM 単位の親和性でプロテインホスファターゼ 2B を阻害します。インターロイキン -1α、リポ多糖、および TNF-α によって誘導される一酸化窒素合成を阻害します。						
Cypermethrin	52315-07-8	416.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (15 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	239900-10MG	19,900
[(R,S)-α-Cyano-3-phenoxybenzyl-3-(2,2-dichlorovinyl) -2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate]	合成 II 型ピレスロイド。カルシニューリン（プロテインフォスファターゼ 2B）の強力な阻害剤です（IC_{50} = 40 pM)。イオンチャネルに対しても様々な作用を示します。						
Deltamethrin	52918-63-5	505.2	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO (15 mg/ml) or Ethanol (1 mg/ml)	253300-10MG	24,900
[(S)-α-Cyano-3-phenoxybenzyl(1R)-*cis*-3-(2,2-dibromovinyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate]	合成 II 型ピレスロイド。カルシニューリン（プロテインフォスファターゼ 2B）の強力な阻害剤です（IC_{50} = 100 pM)。また、イオンチャネルに対しても様々な作用を示します。シナプスにおける神経伝達物質放出の増加を誘発し、シナプトソーム内 Ca^{2+} 濃度を上昇させます。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

プロテインホスファターゼ 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Dephostatin	151606-30-3	168.2	≥ 90% by HPLC	-20℃	Chloroform or DMSO (5 mg/ml)	263200-1MG	23,000
	プロテインチロシンフォスファターゼ阻害剤。ヒト腫瘍性 T 細胞株から調製したプロテインチロシンフォスファターゼを競合的に阻害します(IC_{50} = 7.7 µM)。また、エルシニア菌および哺乳類の同種組換えプロテインチロシンフォスファターゼを濃度・時間依存的に阻害します。細胞内カルシウムストアを移動することが報告されています。タンパク質の S- ニトロシル化における安定な NO 供与体としての役割も果たします。						
eIF4E/eIF4G Interaction Inhibitor, 4EGI-1	315706-13-9	451.3	≥ 95% by HPLC (sum of two isomers)	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	324517-10MG	46,900
[2-((4-(3,4-Dichlorophenyl)-thiazol-2-ylhydrazono)-3-(2-nitrophenyl))propionic acid]	細胞透過性のヒドラゾン化合物。真核生物の翻訳開始因子 4E (eIF4E) に可逆的に結合し (K_d = 25 µM)、eIF4E/eIF4G 相互作用を阻害して 4E-BP1 結合を促進します。cap 依存性翻訳を阻害して IF- 非依存性翻訳を阻害せず、c-Myc および Bcl-xL の発現をダウンレギュレートすることが知られています。また、細胞増殖を抑制し (A549 細胞における IC_{50} = 約 6 µM)、アポトーシスを誘導します。						
Endothall	145-73-3	186.2	≥ 98% by TLC	+4℃	H_2O (25 mg/ml)	324760-20MG	15,900
(7-Oxabicyclo[2.2.1]heptane-2,3-dicarboxylic Acid)	細胞膜透過性の特異的 PP2A 阻害剤 (IC_{50} = 90 nM)。PP1 に対しては弱い作用を示すに過ぎません (IC_{50} = 5 µM)。肝細胞癌細胞株において、G_2/M 期での細胞周期停止を用量・時間依存的に誘導します。						
eIF-2α Inhibitor, Salubrinal		479.8	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	324895-5MG	34,000
(Sal)	真核生物翻訳開始因子 2 サブユニット α (eIF-2α) を脱リン酸化するホスファターゼ複合体の細胞透過性の選択的阻害剤。小胞体ストレス誘発アポトーシスに対する保護を与えることを示します (750 ng/ml のツニカマイシンに刺激された PC12 細胞において EC_{50} = ~15 µM (製品番号 654380)。ベロ細胞 (IC_{50} = ~3 µM、プラーク形成の削減のため) *in vitro* とマウスの角膜感染モデル *in vivo* での HSV 複製を防ぎます。						
eIF-2α Inhibitor II, Sal003	301359-91-1	463.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	324896-5MG	35,000
3-Phenyl-N-(2,2,2-trichloro-1-((((4-chlorophenyl)amino)carbonothioyl)amino)ethyl)acrylamide	eIF2a ホスファターゼ阻害剤 Salubrinal (カタログ番号 324895) の強力かつ細胞透過性のアナログ。水溶解度が増大されています。マウスにおいて長期増強の晩期を防止するとともに、記憶を抑制することが判明しています。						
Fostriecin, Sodium Salt, *Streptomyces pulveraceous*	87860-39-7	452.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	Ethanol (10 mg/ml), Methanol (10 mg/ml), or H_2O (50 mg/ml)	344280-10UG	46,900
(FST; Phosphotrienin)	強力なプロテインフォスファターゼ 2A (PP2A) 阻害剤として作用する抗腫瘍性抗生物質 (IC_{50} = 3.2 nM)。より高濃度においてはプロテインフォスファターゼ 1 (PP1) を阻害します (IC_{50} = 131 µM)。プロテインフォスファターゼ 2B (PP2B) の活性には影響しません。DNA トポイソメラーゼ II (topo II) の触媒活性を阻害し、細胞周期を G_2/M 期で用量依存的に停止させます。						
β-Glycerophosphate, Disodium Salt, Pentahydrate	13408-09-8	306.1	≥ 97% by titration	+4℃	H_2O (5 mg/ml)	35675-50GM 35675-100GM 35675-250GM	9,900 12,000 19,000
(β-GP)	マトリクス鉱化試験におけるリン酸基供与体。血管平滑筋細胞の石灰化を促進します。プロテインフォスファターゼ阻害剤としても作用します。						
Okadaic Acid, Ammonium Salt	155716-06-6	822	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (20 mg/ml), Ethanol (20 mg/ml), or H_2O (1 mg/ml)	459616-25UG	15,900
	Okadaic Acid (製品番号 495604) の水溶性アナログ。プロテインフォスファターゼ 1 および 2A を阻害します。						
Okadaic Acid, Potassium Salt	155751-72-7	843.1	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (20 mg/ml), Ethanol (20 mg/ml), or H_2O (1 mg/ml)	459618-50UG	16,000
	Okadaic Acid (製品番号 495604) の水溶性アナログ。プロテインフォスファターゼ 1 および 2A を阻害します。						
Okadaic Acid, Sodium Salt		827	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (20 mg/ml), Ethanol (20 mg/ml), or H_2O (1 mg/ml)	459620-25UG	17,900
	Okadaic Acid (製品番号 495604) の水溶性アナログ。プロテインフォスファターゼ 1 および 2A を阻害します。						
α-Naphthyl Acid Phosphate, Monosodium Salt	81012-89-7	246.1	≥ 97% by Titration	+4℃	H_2O	479775-5GM	12,000
	標的対象範囲の広いタンパク質フォスファターゼ阻害剤。						
NFAT Activation Inhibitor III	3519-82-2	284.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml). Use only fresh DMSO.	480403-5MG	25,900
(INCA-6; Inhibitor of NFAT-Calcineurin Association-6)	細胞透過性のキノン化合物。カルシニューリン -NFAT (活性化 T 細胞の核因子) シグナル伝達を強力かつ選択的に阻害します。カルシニューリンに高い親和性で結合して (K_d = 0.8 µM) NFAT との相互作用を阻害し、カルシニューリンの脱リン酸化、NFAT の核内輸送 [約 40 µM (C1.7W2 T 細胞)]、およびサイトカイン mRNA の誘導を完全に抑制します。CsA (製品番号 239835) および FK506 とは異なり、INCA-6 はカルシニューリンの活性およびその下流シグナル伝達には影響を与えません。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

プロテインホスファターゼ 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
NIPP-1, His・Tag®, Bovine Thymus, Recombinant, *E. coli*		38500	≥ 90% by SDS-PAGE	-20℃		482251-1UG	27,900
（Nuclear Inhibitor of Protein Phosphatase-1）	プロテインフォスファターゼ 1（PP1）の強力かつ特異的な阻害剤（K_i = 1-10 pM）。PP2A、PP2B、PP2C を含む他の主要なセリン / スレオニンプロテインフォスファターゼから PP1 を区別する際に用いられます。また、プロテインキナーゼ A およびカゼインキナーゼ II の基質となります。PP1 の RNA 関連基質へのターゲッティングに関与すると考えられ、また、CREB や腫瘍抑制遺伝子 Rb のような転写因子の脱リン酸化にも関与しているとされます。						
Okadaic Acid, *Prorocentrum concavum*	78111-17-8	805	≥ 95% by HPLC	-20℃	Methanol, ethanol, DMF, or $CHCl_3$	495604-25UG 495604-100UG	16,900 54,900
（OA）	発がん促進性を有する C_{38} 脂肪酸化合物のイオノフォア様ポリエーテル誘導体。プロテインフォスファターゼ 1（IC_{50} = 10-15 nM）およびプロテインフォスファターゼ 2A（IC_{50} = 0.1 nM）の強力な阻害剤。チロシンフォスファターゼ、アルカリフォスファターゼまたは酸性フォスファターゼの活性には影響しません。細胞抽出液およびインタクトな細胞におけるプロテインフォスファターゼの研究に有用です。ヒト乳がん細胞（MB-231 および MCF-7）および骨髄性細胞においてアポトーシスを誘導しますが、T 細胞ハイブリドーマではグルココルチコイド誘導性アポトーシスを阻害します。平滑筋および心筋に対して顕著な収縮効果を示すほか、下痢性貝中毒の原因物質とも考えられています。						
InSolution™ Okadaic Acid, *Prorocentrum concavum*		805	≥ 95% by HPLC	-20℃		495609-25UG	19,900
	Okadaic Acid、*Prorocentrum concavum*（製品番号 495604）の 250 µM（25 µg/124 µl）DMSO 溶液です。						
PD 166285	212391-63-4	585.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	513028-5MG	18,900
PD 166285	細胞透過性で経口投与可能な ATP 競合性の広域チロシンキナーゼ阻害剤（c-Src、Wee1、FGFR-1、Myt1、EGFR、および PDGFRb に対する IC_{50} はそれぞれ 8.4、24、39.3、72、87.5、および 98.3 nM）。*in vitro*（HUVEC 微小毛細血管形成アッセイにおける最大阻害用量は 100 nM）および *in vivo*（マウス Matrigel プラグ血管新生アッセイにおける最大阻害投与量は経口で 5 mg/kg）おいていずれも血管新生を抑制する一方、Chk1、MAPK、および PKC に対する阻害能はより低く（IC_{50} はそれぞれ 3.4、5、および 22.7 µM）、IRTK および Cdk4/D1 に対しては濃度 50 µM においてもほとんど阻害活性を示しません。ラット大動脈平滑筋細胞において、PDGF、EGF、および bFGF の各刺激による受容体のリン酸化（IC_{50} はそれぞれ 6.5、1600、および 97.3 nM）およびその他の細胞応答を効果的に阻止することが判明しています。また、50 ng/ml nocodazole（製品番号 487928）治療併用時に 500 nM PD 166285 により細胞の Wee1 活性を阻害すると、ヒト癌細胞 7 種類において Tyr15 および Thr14 における放射線誘発性の Cdc2 リン酸化が阻止されることが報告され、特に放射線誘発性の細胞死に対する PA-1 培養の感受性が p53 依存的に増大することが判明しています。						
Phenylarsine Oxide	637-03-6	168	≥95% by elemental analysis	room temp.	$CHCl_3$（100 mg/ml）or DMSO（50 mg/ml）	521000-250MG	10,000
（Oxophenylarsine; PAO）	膜浸透性タンパク質チロシンフォスファターゼ阻害物質（IC_{50}= 18 µM）。 インスリン抵抗性ヒト骨格筋における 2- デオキシグルコースの輸送を促進し、また $p56^{lck}$ タンパク質チロシンキナーゼを活性化します。ヒト骨髄 ML-1a 細胞における NF-κB の TNF-α 依存的活性化を阻害します。PAO は組換えヒトカスパーゼ、およびニワトリ前アポトーシス DU249 細胞抽出物（S/M 抽出物）中の活性内因性カスパーゼのプロテアーゼ活性を阻害します。100 µM で核のアポトーシスによる形態変化を *in vitro* で阻害します。また S/M 抽出物中のヌクレオソーム間 DNA 断片化を阻害しますが、このとき PARP あるいはラミン A の開裂は阻害しません。またヒト好中球において NADPH オキシダーゼを完全かつ可逆的に阻害することも知られています。						
PPM1D Phosphatase Inhibitor	1087-07-6	272.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（1.5 mg/ml）; Do Not Warm	529578-10MG	22,000
CCT007093	細胞透過性のチエニリジンシクロペンタノン化合物。PPM1D 阻害剤として作用し（IC_{50} = 8.4 µM）、PPM1A（IC_{50} > 100 µM）よりも高い選択性を示します。p38 リン酸化を誘導し、PPM1D を過剰発現している腫瘍細胞の増殖を HeLa および HEK 293T 細胞（それぞれ IC_{50} > 50 µM および >34 µM）よりも強力に抑制する（MCF-7、KPL-1 および MCF-3B 細胞における SF50 はそれぞれ 0.48 µM、0.17 µM および 0.13 µM）ことが判明しています。						
Protein Phosphatase 2A Inhibitor I2PP2A, Human, Recombinant, *E. coli*			≥ 90% by SDS-PAGE	-70℃		539620-250NG	60,000
（I_2^{PP2A}; Protein Phosphatase 2A Inhibitor I）	プロテインフォスファターゼ 2A（PP2A）に特異的な強力かつ熱安定的阻害物質。ミエリン塩基性タンパク質、ヒストン H1 タンパク質あるいはフォスフォリラーゼを基質とする PP2A の反応を阻害しますが、カゼインを基質とする反応は阻害しません。PP2A を非競合的に阻害します（ミエリン塩基性タンパク質を基質とするとき K_i= 30 nM）。プロテインフォスファターゼ 1、プロテインフォスファターゼ 2B、プロテインフォスファターゼ 2C、あるいはピルビン酸デヒドロゲナーゼフォスファターゼは阻害しません。						
Protein Phosphatase Inhibitor 2, Human, Recombinant, *E. coli*			≥ 95% by SDS-PAGE	-20℃	Reconstitute with 50 mM Tris-HCl, pH 7.0.	539638-100UG	55,900
（I-2; Inhibitor-2）	Inhibitor-2 は細胞質 1 型 Ser/Thr プロテインフォスファターゼ 1（PP1）の調節サブユニットです。遊離の PP1 触媒サブユニットの活性を強力に阻害します（IC_{50} = 1 nM）。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

プロテインホスファターゼ 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
PTP1B Inhibitor		741.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	539741-5MG	45,900
[3-(3,5-Dibromo-4-hydroxy-benzoyl)-2-ethyl-benzofuran-6-sulfonicacid-(4-(thiazol-ylsulfamyl)-phenyl)-amide]	細胞透過性のスルファンアミド - ベンズプロマロン化合物。PTP1B に対する選択的かつ可逆的な非競合アロステリック阻害剤として作用します [IC_{50} = 4 μM (PTP1B_{403})、8 μM (PTP1B_{298})]。触媒ポケットから離れた新規部位に結合し、WPD ループの閉鎖を防ぐことによって PTP1B 活性を阻害します。IR、IRS-1、および Akt のリン酸化によって 250 μM で CHO-hIR 細胞におけるインスリンシグナル伝達を誘導することが明らかになっています。						
InSolution™ PTP1B Inhibitor		741.5	≥ 97% by HPLC	-20℃		539749-2MG	26,900
PRL-3 Inhibitor		485.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) . Slight warming may be necessary for complete solubilization.	539808-10MG	36,000
[1-(2-Bromobenzyloxy)-4-bromo-2-benzylidene rhodanine]	細胞透過性のベンジリデンローダニン化合物。再生肝ファミリーチロシンフォスファターゼのメンバーである hPRL-3 を強力に阻害します (IC_{50} = 900 nM)。マウスメラノーマ B16F10 細胞の侵襲性を抑えることが示されています。						
Protein Tyrosine Phosphatase Inhibitor I	2491-38-5	215.1	≥ 95% by HPLC	-70℃	DMSO (200 mg/ml)	540200-10MG	31,900
(α-Bromo-4-hydroxyacetophenone; 4-Hydroxyphenacyl Br; PTP Inhibitor I)	プロテインチロシンフォスファターゼ (PTP) の強力な細胞浸透性共有結合型阻害物質。SH2 ドメインを含んだフォスファターゼ SHP-1 の触媒ドメインである SHP-1 (δSH2) を阻害します (K_i= 42 μM)。不活性化された PTP に 350 nm の光を照射すると阻害から回復します。						
Protein Tyrosine Phosphatase Inhibitor III		273.1	≥ 90% by HPLC	-70℃	DMSO (200 mg/ml)	540210-10MG	31,000
[α-Bromo-4-(carboxymethoxy)acetophenone; 4-(Carboxymethoxy)phenacyl Br; Protein Tyrosine Phosphatase Inhibitor III]	プロテインチロシンフォスファターゼ (PTP) の強力な細胞浸透性共有結合型阻害物質。SH2 ドメインを含んだフォスファターゼ SHP-1 の触媒ドメインである SHP-1 (δSH2) と結合します。親和性は PTP Inhibitor I (製品番号 540200) を下回りますが (PTP Inhibitor I の K_i= 42 μM に対して K_i= 193 μM)、k_{inact} は上回ります (PTP Inhibitor I の 0.4 min^{-1} に対して 1.8 min^{-1})。不活性化された PTP に 350 nm の光を照射すると阻害から回復します。						
Protein Tyrosine Phosphatase Inhibitor IV		608.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or ACN	540211-10MG	24,900
[*bis*(4-Trifluoromethylsulfonamidophenyl)-1,4-diisopropylbenzene; Protein Tyrosine Phosphatase Inhibitor IV]	荷電していない 1,4- 二置換フェニル結合ビス - トリフルオロメチル - スルホンアミド (TFMS) リン酸様物質。プロテインチロシンフォスファターゼ (PTP) に対する強力で可逆的かつ競合的な活性部位特異的阻害剤として作用します [IC_{50} = 1.8 μM (SHP-2)、2.5 μM (PTP1B)、8.4 μM (PTP-ε)、13 μM (PTP-Meg-2)、20 μM (PTP-σ)、6.4 μM (PTP-β)、6.7 μM (PTP-μ)]。						
PTP Inhibitor V, PHPS1	314291-83-3	465.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	540213-10MG	30,000
PhenylHydrazonoPyrazolone Sulfonate 1	細胞透過性のフェニルヒドラゾンピラゾロンスルフォン酸化合物で、フォスフォチロシンの作用を模倣する活性部位を作用標的とした、SHP-2 の競合的可逆的阻害剤として作用します (SHP-2、ECPTP、PTB1B、SHP-1、PTPH1、STEP、PTPN7、PTPRK、GLEPP1、LAR2 および MptpA に対する IC_{50} はそれぞれ 2.1、5.4、19、30、> 50、> 50、> 50、> 50、> 50、> 50、39 μM。また SHP-2、SHP2-R362K、SHP-1、PTP1B および PTP1B-Q に対する K_i はそれぞれ 0.73、5.8、10.7、5.8 および 0.47 μM)。濃度 5 μM において MDCK (Madin-Darby canine kidney) 上皮細胞の HGF-SF (肝細胞増殖因子 / 散乱因子) 誘導性形態形成 (散乱・分枝) および SHP-2 依存性 Ras/MAP キナーゼ経路を阻害することが判明しています。さらに、ヒト腫瘍細胞数種の増殖およびコロニー形成を抑制します。						
PTP CD45 Inhibitor		307.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	540215-5MG	36,900
[N-(9,10-Dioxo-9,10-dihydro-phenanthren-2-yl)-2,2-dimethyl-propionamide; Protein Tyrosine Phosphatase CD45 Inhibitor; PTPase CD45 Inhibitor]	増殖抑制作用を示す、9,10- フェナントレンジオンコアを有する細胞透過性ピバルアミド。CD45 に対する強力で選択的かつ競合的な可逆的阻害剤として作用します [IC_{50} = 200 nM (*p*NPP 基質)、3.8 μM (CD45 *lck*)、> 30 μM (PTP1B lck)]。細胞毒性が弱く (IC_{50} = 3.5 μM)、T 細胞受容体を介した細胞増殖を強力に抑制する (IC_{50} = 0.1 μM) ことが明らかになっています。フェナントレンジオン基は、チオール酸化剤としては機能しません。						
PTP Inhibitor XVIII		526.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml)	540216-10MG	20,000
	PTP1B、SHP-1、YOP、TC-PTP、YPTP1 (IC_{50} = 各 5、5.8、6、16、18 μM) の酵素活性を阻害するが、濃度 100 μM の時点でさえも LAR は阻害しないことが示されている細胞透過性チアゾリジンジオン化合物。また、トログリタゾン (製品番号 648469) で見られるのと同等の有効性を持つ細胞 PPAR を活性化することが報告されています。PTP1B 阻害と PPAR 活性の結合効果は、C57BL/6j jms Slc オスのマウス (2 mg/g 食品、動物重量 ~143 mg/kg または 4.8 mg/ 動物) の毎日の高脂肪の食事に直接補給されたとき、化合物の *in vivo* 抗肥満ならびに抗低血糖活性になる可能性が高くなります。						
PTP LYP Inhibitor		495.69	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	540217-5MG	29,000
(2-pyridine)(Ph)2P-Au-Cl	リンパ球のチロシンホスファターゼ (LYP) (IC_{50}= 1.5 μM) の選択的阻害剤として働き、JTAg 細胞と初代マウス胸腺細胞の両方で、PTP-PEST や HePTP、CD45 ではなく LYP を選択する最大 10 倍の選択性を持つ細胞透過性の Au (I) - ホスフィン複合体。						
SHP1/2 PTPase Inhibitor, NSC-87877	56932-43-5	503.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	H_2O (10 mg/ml)	565851-50MG	23,900
[8-Hydroxy-7-(6-sulfonaphthalen-2-yl)diazenyl-quinoline-5-sulfonic acid, Disodium Salt]	細胞透過性の 7- アザ -8- ヒドロキシキノリン化合物。SHP-1 および SHP-2 タンパク質チロシンホスファターゼの触媒部位を標的とした強力な阻害剤として作用します (それぞれ、IC_{50} = 355 nM および 318 nM)。PTP1B および HePTP は、より弱い効力で阻害し (それぞれ、IC_{50} = 1.69 μM および 7.75 μM)、DEP1、CD45 および LAR に対するよりも 200 倍以上高い選択性を示します。HEK293 細胞において基底状態および刺激された SHP-2 の活性を阻害することが示されています。						
Sodium Orthovanadate	13721-39-6	183.9		room temp.	H_2O (10 mg/ml)	567540-5GM	10,900
	スペクトルが広く強力なプロテインチロシンフォスファターゼ阻害剤。また、Na^+、K^+-ATP アーゼ、酸性およびアルカリフォスファターゼ、フォスフォフラクトキナーゼおよびアデニル酸キナーゼも阻害することが知られています。また、マイクロモル濃度の範囲で、再構成したネズミチフス菌 (*Salmonella typhimurium*) のマルトース (MalFGK$_2$) に対する結合タンパク質依存性 ATP 結合カセット (ABC) トランスポーターの ATP アーゼ活性を阻害します。過酸化水素によって Pervanadate へと変換されます。						

プロテインホスファターゼ 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Sodium Stibogluconate	16037-91-5	907.9	≥ 90% by titration on dry basis (≥ 30% Sb content)	+4℃	H_2O（1 mg/ml）. Heating to 75℃ ;C with constant stirring or constant stirring overnight at room temperature may be required for complete solubilization.	567565-1GM	22,900
（Antimony Sodium Gluconate; $NaSb^{v}$; SSG）	5 価アンチモン化合物。Src 相同 PTPase-1（SPH-1）などのプロテインチロシンフォスファターゼ（PTPase）の活性を、安定な複合体を形成することによって不可逆的に阻害します。高濃度では SHP-2 および PTP1B の活性を阻害しますが、2 重特異性フォスファターゼであるマイトジェン活性化プロテインキナーゼフォスファターゼ 1（MKP1）には著しい影響を与えません。細胞質タンパク質のチロシンリン酸化を誘導し、Baf3 細胞における IL-3 誘導性の Jak2/Stat5 リン酸化を促進すると考えられています。抗リューシュマニア作用を示します。						
Tautomycin, *Streptomyces spiroverticillatus*	109946-35-2	767	≥ 97% by HPLC	-20℃	Chloroform, ethanol, or methanol	580551-50UG	56,900
Tautomycin,*Streptomyces spiroverticillatus*	2 種類の異性体の混合物。強力なプロテインフォスファターゼ阻害剤であり、タンパク質リン酸化に関する研究に有用です。プロテインフォスファターゼ 1（IC_{50} = 1 nM）、プロテインフォスファターゼ 2A（IC_{50} = 10 nM）、および平滑筋内因性フォスファターゼ（IC_{50} = 6 nM）を阻害します。プロテインフォスファターゼ 2B の阻害には、さらに高い濃度が必要です。プロテインフォスファターゼ 2C およびフォルボールジブチレート結合は阻害しません。プロテインキナーゼ C の活性化作用およびミオシン軽鎖キナーゼの阻害作用は示しません。						
TNAP Inhibitor		344.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	613810-10MG	19,900
	胎盤性アルカリホスファターゼや腸型アルカリホスファターゼ（IC_{50} > 100 µM）、PHOSPHO1 ホスフォターゼや NPP1 ホスホジエステラーゼなどを含む酵素に関連するほかの 250 以上のアッセイにおいてほとんど、あるいは全く阻害活性を示さない一方、CYP2C19 のみが既知の標的である組織非特異性（TN）アルカリホスファターゼ（AP）活性（IC_{50} = 190 nM）に対する有効な可逆的阻害剤として働く細胞透過性キノリニルベンゼンスルホンアミド化合物。動態検査ではリン酸供与体基質に対して阻害は競合せず、アロステリック阻害機構を示すアクセプター基質に対しては非競合です。ラットへの *in vivo* 皮下投与は、治療域においてプラズマ阻害濃度になると報告されています（皮下注射 4.13 mg/kg 後 Cmax = 1.5 µg/ml 1 hr ）。						

タンパク質リン酸化・脱リン酸化

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Adenosine Kinase Inhibitor	214697-26-4	536.3	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml)	116890-5MG	53,000
[ABT-702; 4-Amino-5-(3-bromophenyl)-7-(6-morpholino-pyridin-3-yl) pyrido[2,3-d] pyrimidine, 2HCl]	細胞透過性のピリドピリミジン化合物であり、強力かつ可逆的なアデノシン競合性の非ヌクレオシド型アデノシンキナーゼ阻害剤として作用します(さまざまな哺乳類動物種において 0.8 ～ 3.0 nM の範囲の IC_{50} を示します。IMR-32 細胞では 50.7 nM)。アデノシンレセプター(A1、A2A および A3)、輸送部位、デアミナーゼに対するよりも約 2,000 倍高い選択性を示します。経口で活性を示し、内在性のアデノシン量を増加させて、痛覚および炎症の動物モデルにおいて抗侵害受容性効果を生じると報告されています。						
BCL6 Inhibitor, 79-6		457.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	197345-50MG	39,900
BRD2 Inhibitor II, BIC1		340.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	203830-10MG	48,900
eEF-2 Kinase Inhibitor, NH125	278603-08-0	524.6	≥ 95% by NMR	+4℃	DMSO (20 mg/ml) or 70% Ethanol (5 mg/ml)	324515-5MG	45,000
(1-Benzyl-3-cetyl-2-methylimidazolium iodide; CaM-Dependent Kinase III Inhibitor, NH125; 1-Cetyl-3-benzyl-2-methylimidazolium iodide)	細胞透過性のイミダゾリウム化合物。真核生物延長因子 2 キナーゼ(eEF-2 キナーゼ)を選択的に阻害し(eEF-2K、PKC、PKA および CaMKII に対する IC_{50} = 60 nM、7.5 μM、80 μM および >100 μM)、C6 グリオーマ細胞において eEF-2 のリン酸化を阻害します。細菌のヒスチジンプロテインキナーゼを阻害し、細胞周期停止を誘導していくつかのグラム陰性菌の増殖を抑制します(MIC < 3.12 μg/ml)。						
Gentamycin Sulfate	1405-41-0			+20℃	H2O	345814-1GM	16,000
GSK-3b Inhibitor XXVII		634.8	≥ 99% by HPLC	-20℃	DMSO	361570-10MG	38,900
Hypothemycin	76958-67-3	378.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO	401011-500UG	41,000
IRAK-1/4 Inhibitor	509093-47-4	395.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	407601-5MG	25,900
[IRAK-1/4 Inhibitor; N-(2-Morpholinylethyl)-2-(3-nitrobenzoylamido)-benzimidazole]	細胞透過性のベンゾイミダゾール化合物。インターロイキン 1 受容体関連キナーゼの強力かつ選択的な阻害剤として作用します(IRAK-1 および -4 に対する IC_{50} = 300 nM および 200 nM)。lck や src などを含む他の 27 種類のキナーゼパネルに対しては、ほとんど活性を示さないことが明らかになっています(IC_{50} > 10 μM)。						
PP1 Analog III, 3-MB-PP1	956025-83-5	295.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	529582-5MG	19,900
1-(*tert*-Butyl)-3-(3-methylbenzyl) -1H-pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-4-amine	野生型や非特異的細胞酵素に対してほとんど、あるいは全く活性がない一方、ポロ様キナーゼ 1C67V L130G(それぞれ 75% ならび 94% 阻害、無細胞キナーゼアッセイ、0.1 ならびに 1 μM)や ZAP-70C405V M414A/ZAP-70M414A(αTCR 刺激前後に適用した際の ASKA トランスフェクタントにおける αTCR 刺激 [Ca^{2+}] の上昇の完全阻止／削除、6 μM 時)、SykM442A S505A(ASKA マクロファージによるオプソニン化 SRBC の食作用の 56% 阻害、6 μM 時)に対して、有効な ATP 競合的の高い ASKA-(類似体感受性のキナーゼ対立遺伝子)選択的阻害剤として働く細胞透過性 C3 膨張 PP1(製品番号 567809)類似体。機能的類似体感受性の対立遺伝子突然変異体は、自然発生の標的酵素に対する特異的な阻害剤が手に入らないときや、標的酵素を欠くノックアウト動物／細胞の生成が困難だったり、実行できなかったり、単純に不可能と思われるときに、培養 *in vitro* や動物 *in vivo* の両方で酵素シグナリングや機能を解明したり、薬剤開発の薬理学的検証したりするのに有益なツールです。						
TX-1918		228.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	655203-10MG	26,000
[2-((3,5-dimethyl-4-hydroxyphenyl)-methylene) -4-cyclopentene-1,3-dione]	アリリデン - シクロペンテンジオンに由来する、細胞透過性のチルフォスチン。eEF2-K の強力な阻害剤として作用し(IC_{50} = 440 nM)、極めて高濃度で他のキナーゼを阻害します [IC_{50} = 4.4 μM(Src)、44 μM(PKA)、44 μM(PKC)、440 μM(EGFR-K)]。別のチルフォスチン AG 17(製品番号 658425)と比較して、強力な抗腫瘍作用を示し [EC_{50} = 2.07 μM(HepG2 腫瘍細胞)、230 μM(HCT116 腫瘍細胞)]、ミトコンドリア毒性(≥ 1/5,000)および肝毒性(≥ 1/90)が大幅に低下しています。したがって、本品はより有望ながん治療薬の候補物質です。						
DAPK Inhibitor	315694-89-4	276.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml)	324788-10MG	15,900
(4Z)-4-(3-Pyridylmethylene)-2-styryl-oxazol-5-one, Death-Associated Protein Kinase Inhibitor	10 μM の濃度のときでさえ他のキナーゼ 48 種類のパネルに対して活性が非常に少ない、あるいは全くないことを示す一方、有効な ATP 競合の非常に選択的な細胞死関連タンパク質キナーゼ(DAPK)阻害剤(10 μM ATP のとき DAPK1 と DAPK3 に対し IC_{50} = それぞれ 69 ならびに 225 nM)として働くオキサゾロン化合物。						
Hexokinase II Inhibitor II, 3-BP		166.96	≥ 97% by Titration	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	376817-100MG	10,900
	キナーゼ II 介在の解糖に対して阻害剤として働き、培養 *in vitro* とマウスとラット *in vivo* において腫瘍生存を効果的に抑制する細胞透過性のピルビン酸誘導体。						
Quercetagetin	90-18-6	318.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	551590-5MG	60,000
(3,3',4',5,6,7-Hexahydroxyflavone)	細胞透過性のフラバノール化合物。PIM1 キナーゼの強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し(*in vitro* および RWPE2/hpim1 細胞(pBADSer112 をモニタリング)において IC_{50} = 340 nM および 5.5 μM)、RSK2,PIM2,Aurora-A および PKA には適度な選択性を示します(それぞれ IC_{50} = 2.82 μM、3.45 μM、4.0 μM および、21.2 μM)。Akt、JNK、c-Raf および PKCq の活性をごくわずかに阻害し(1.0 μM で 0% から 41% の阻害)、c-Abl に対しては 200 μMμ でもまったく阻害を示しません。						

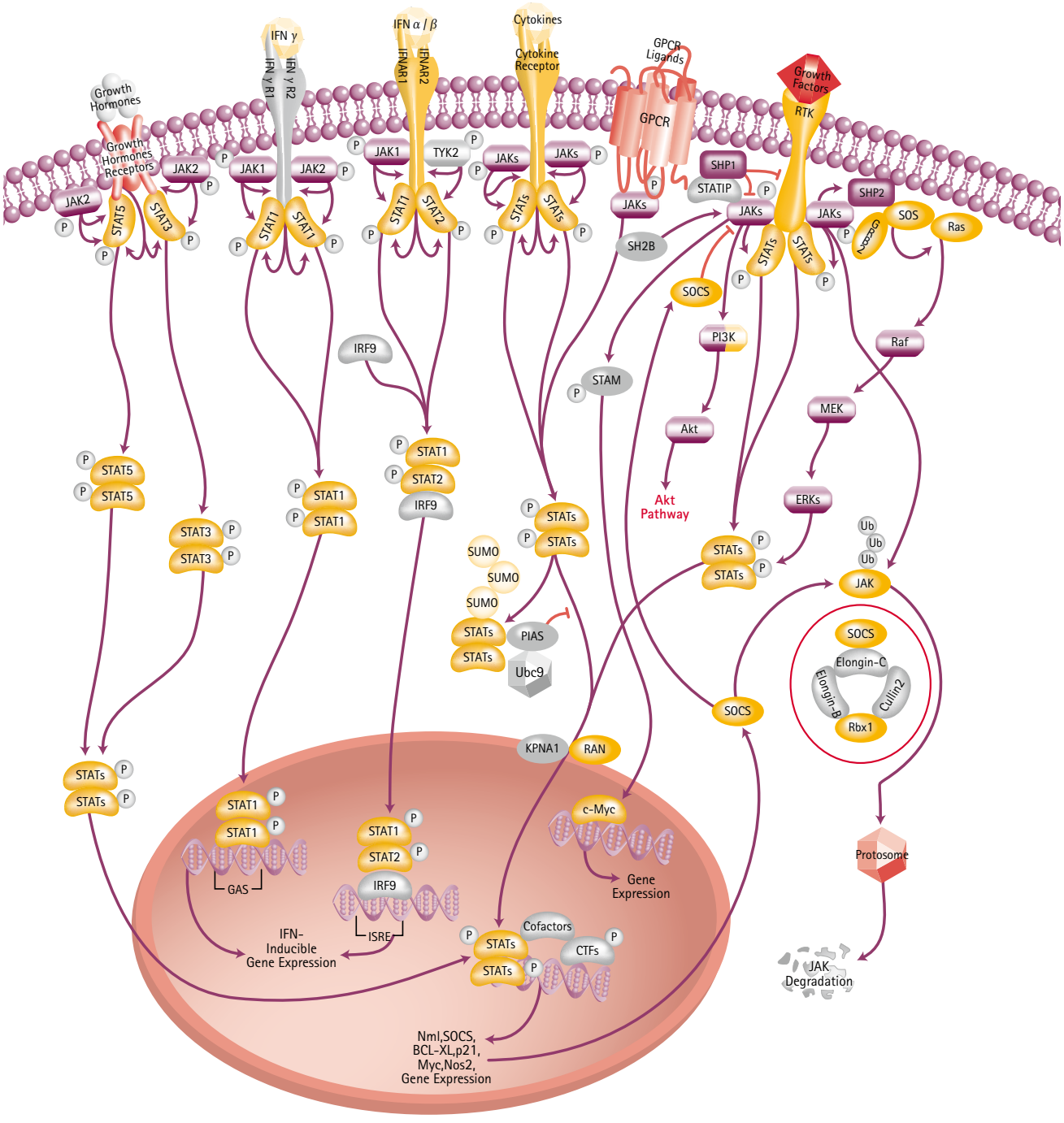
血管新生阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
HIF-1 Inhibitor		435.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	400083-10MG	25,900
3-(2-(4-Adamantan-1-yl-phenoxy)-acetylamino)-4-hydroxybenzoic acid methyl ester; Hypoxia-Inducible Factor-1 Inhibitor	細胞透過性のアミドフェノール化合物。細胞内 HIF-1α タンパク質の低酸素誘発蓄積を選択的に抑制することによって低酸素誘発 HIF-1 転写活性を阻害し（レポーターアッセイにおける AGS および Hep3B 細胞に対する IC_{50} = 0.7 および 2.6 μM）、HIF-1αmRNA および HIF-1β タンパク質の細胞内レベルには明らかな影響を示しません。						
HIF Prolyl Hydroxylase Inhibitor	385786-48-1	377.82	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）	400084-10MG	24,900
	ルシフェラーゼへ HIF-1α 酸素分解性ドメイン（ODD）を溶解することで生成されたレポーターを使用して細胞ベースのアッセイに IC_{50} = 2 μM を表示する細胞透過性ヒドロキシキノリン HIF プロリルヒドロキシラーゼ（PHD）阻害剤。この化合物は、HIF-1α *in vitro* を著しく安定させ、SH-SY5Y ヒト神経芽腫細胞株における既知の HIF の標的遺伝子 Epo ならびに VEGF を上方制御することを示しています。また、皮質ニューロンを使用して酸化的ストレスモデルにおける神経保護的効果（IC_{50} = 0.25 μM）も働かせます。						
HIF-2α Translation Inhibitor		287.3	≥95% (sum of two isomers)	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	400087-10MG	16,900
Methyl-3-(2-(cyano(methylsulfonyl)methylene)hydrazino)thiophene-2-carboxylate	細胞透過性のチエニルヒドラゾン化合物。HIF-2α mRNA の 5' 非翻訳領域における IRE（鉄反応エレメント）領域への IRP1（鉄調節タンパク質 1）の結合を増強することによって細胞の HIF-2α メッセージの翻訳を抑制しますが、HIF-2α mRNA の転写あるいは HIF-2α mRNA およびタンパク質の安定性には影響しません。低酸素誘導性因子の 2α アイソフォームのみを発現している 786-O 細胞において、HIF-2α および HIF-2α 標的遺伝子（Glut-1, IGFBP3, および VEGF など）のタンパク質レベルを低下させることが判明しています（最終濃度 5-10 μM）。						
HIF-1α Translation Inhibitor, KC7F2	927822-86-4	570.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）	400088-25MG	30,900
KC7F2	HIF-1α mRNA の転写や HIF-1α タンパク質の安定性に影響を及ぼすことなく、HIF-1β ではなく細胞 HIF-1α タンパク質合成を選択的に抑制する細胞透過性の対称ヒスタミン化合物。KC7F2 処理（IC_{50} <20 μM、低酸素の状況下で LN229 培養）による細胞 HIF-1α の減少は、CA IX、エンドセリン 1、エノラーゼ 1 や MMP-2 など HIF-1α 依存性遺伝子の転写の低減をもたらすことを示しています。タンパク質の翻訳の阻害にとって重要な出来事である 4EBP1 と S6K のリン酸化反応の阻害もまた、低酸素の状況での KC7F2 処理に続く KC7F2 ならびに U87MGD 培養において認められます。これが、少なくともある程度は HIF-1α 合成の下方制御の理由と思われます。						
HIF-1α/2α Inhibitor IV, FM19G11	329932-55-0	463.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml）	400089-10MG	17,900
2-Oxo-2-((p-tolyl)ethyl)-3-((2,4-dinitro)benzamido)-benzoate	細胞透過性のベンズアミド安息香酸化合物。HeLa 培養における低酸素誘導性の HIF-1α および HIF-2α タンパク質量の増大を阻止し、その結果低酸素条件下（1% O_2）において HIF 応答エレメント（HRE）を介した転写活性を阻害します（HeLa ベースのルシフェラーゼレポーターアッセイにおける IC_{50} = 80 nM）。FM19G11 により、ラット epSPC（上衣幹 / 前駆細胞）およびヒト hESC（胚性幹細胞）培養のいずれにおいても低酸素条件下で HIF-2α 依存性の Oct4 および Sox2 mRNA の蓄積が用量依存的に減少し、その結果 500 nM FM19G11 で 48 時間処理後の細胞 Oct4 および Sox2 タンパク質量が 50% 減少します。						
HIF-Hydroxylase Inhibitor, DMOG	89464-63-1	175.1	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO	400091-50MG	23,900
H-Gly-Pro-Arg-Pro-OH	67869-62-9	425.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	5% acetic acid（1 mg/ml）	03-34-0001-25MG	28,000
	フィブリノーゲン凝集およびフィブリン重合の阻害剤。						
AhR Antagonist		333.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	182705-10MG	36,900
[CH-223191; 2-Methyl-2H-pyrazole-3-carboxylic acid-(2-methyl-4-*o*-tolyl-azophenyl)-amide]	細胞透過性のピラゾロアミド化合物。用量依存的に TCDD（2,3,7,8- テトラクロロジベンゾ -p- ジオキシン）の AhR（アリール炭化水素受容体）への結合を強力に妨げます。*in vitro* の HepG2 細胞で TCDD が誘導する AhR 転写活性を阻害すること（IC_{50}=30 nM）、およびマウス *in vivo* で TCDD が引き起こす肝毒性と消耗症候群を防ぐことが示されています。一般的に使用される AhR アンタゴニストのフラボンとは異なり、この阻害剤はエストロゲン受容体の転写活性に対する影響がありません。また、10 μM の高濃度でも TCDD 様アゴニスト活性を示しません。						
Captopril	62571-86-2	217.3	≥ 98% by titration	+4℃	H_2O（1 mg/ml）	211875-1GM	13,900
([2S]-1-[3-Mercapto-2-methylpropionyl]-L-proline; SQ-14225)	LTA_4 加水分解酵素に対する可逆的かつ競合的な阻害剤（IC_{50} = 11 μM）として作用する降圧剤です。アンジオテンシン変換酵素（ACE）に対しても競合的阻害作用を示します（IC_{50} = 23-35 nM）。ラットにおいて、血管新生を阻害し、実験的腫瘍の増殖を遅延させます。ヒト肺上皮細胞においてアポトーシスを阻害することが報告されています（IC_{50} = 約 320 nM）。						
Fibroblast Growth Factor-2 Inhibitor, NSC37204		548.45	>95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	341598-10MG	21,000
	用量依存的に血管新生因子 FGF-2（IC_{50} = 1.3 μM）に対して結合ドメイン TSP-1 と競合し、内皮細胞（IC_{50} = 24.0 ±6.9 μM）、*in vitro* において FGF-2 が HSPG に結合するのを防ぐ小分子の化合物。また、血清誘発の内皮細胞（IC_{50} = 20.3 μM ±5.9 μM）においては成長抑制特性を示しませんが、FGF-2 誘発性の内皮細胞において成長抑制特性を示します。CAM アッセイ *in vivo* においては、血管形成がゼラチンスポンジに埋め込まれた FGF-2 に誘発されるところで、小分子（0.5 μg）の存在は、26 ±4（FGF-2 alondsde）から 10 ±2（FGF-2 + NSC37203）までスポンジに入る血管の平均値を下げます。						
Fumagillin, *Aspergillus fumigatus*	23110-15-8	458.6	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO, aqueous alkaline solutions, and chloroform（10 mg/ml）	344845-500UG	22,900
（Fumidil B）	抗原生動物剤であり、かつ血管新生阻害剤でもあります。ハチの胞子虫類寄生虫および魚類の myxozoan 寄生虫に対して活性を示します。						
4-Hydroxyphenylretinamide	65646-68-6	391.6	≥ 97% by TLC	-20℃	Acetone, DMSO（25 mg/ml）, or Ethanol	390900-5MG	31,000
[Fenretinide; 4HPR; N-(4-Hydroxyphenyl)-all-*trans* Retinamide]	all-*trans* レチノイン酸（RA）の合成アミド。RA よりも毒性が低いものの、高い生物学的活性を保っています。動物の様々な腫瘍に対して予防および治療活性を示します。ヒト乳がん、前立腺腺がん、および卵巣がん細胞の増殖を阻害します。血管新生、内皮細胞の移動および管形成を阻害します。悪性造血細胞株のアポトーシスを誘導します。						
2-Methoxyestradiol	362-07-2	302.4	≥ 90% by HPLC	room temp.	DMSO or Ethanol	454180-10MG 454180-50MG	15,000 50,000
[2-Methoxy-3,17β-dihydroxyestra-1,3,5(10)-triene]	エストロゲン活性を示さない、天然の 17β- エストラジオール代謝物。細胞の増殖および血管新生を阻害します。マウスにおいて、固形がんの血管新生を顕著に阻害し、腫瘍の成長を抑制します。チューブリンのコルヒチン結合座位に結合します。また微小管の形成および機能に対する天然調節因子として機能するといわれています。						
Mifepristone	84371-65-3	429.6	≥ 99% by titration	+4℃	Ethanol（10 mg/ml）	475838-50MG	15,000
[(11β,17β)-11-(4-(Dimethylamino)phenyl)-17-hydroxy-17-(1-propynyl)estra-4,9-dien-3-one]	細胞透過性の合成ステロイドで、プロゲステロンとグルココルチコイドリセプターの強力なアンタゴニスト。P 糖タンパク質 P-glycoprotein（P-gp）機能を阻害し、P-gp を介する薬剤耐性を抑えます。抗血管新生作用を有し、VEGF（vascular endothelial growth factor）を抑制します。マウス子宮内膜で Fas と FasL の発現、および前立腺がんでの TRAIL の発現を制御します。また、抗酸化作用を有し、controlled cortical impact（CCI）から神経（CA1 pyramidal 細胞）を保護し、β アミロイド、H_2O_2-, グルタミン酸 - に誘導されるマウス海馬 HT22 細胞を傷害から保護する作用をもちます。						

血管新生阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Shikonin	517-89-5	288.3	≥ 97% by TLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	565850-10MG	19,000
	漢方薬の紫雲膏の成分であるナフトキノン。顕著な抗細菌、抗炎症、抗腫瘍活性を有します。マウスにおいて TNF-α 誘導性、B-16 メラノーマ誘導性の血管新生を阻害します。インテグリン $\alpha_v\beta_3$ の発現を妨げ、内皮細胞の増殖および移動を *in vitro* で阻害します。また、HL60 ヒト前骨髄球性白血病細胞株でアポトーシスを誘導します。						
(±)-Thalidomide	50-35-1	258.2	≥ 98% by TLC	room temp.	DMSO (25 mg/ml)	585970-100MG	25,900
[(±)-2-(2,6-Dioxo-3-piperidinyl)-1H-isoindole-1,3(2H)-dione]	TNF-α 生合成の選択的阻害剤。角膜における塩基性繊維芽細胞成長因子 (bFGF) 誘導性の血管形成をブロックします。HIV-I ウイルスの複製を阻害する免疫調節物質。AIDS 関連口腔潰瘍の治療に使用されています。						
Tranilast	53902-12-8	327.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml)	616400-10MG	24,900
[N-(3′,4′-Dimethoxycinnamoyl)anthranilic Acid]	アントラニル酸アナログ。VEGF および血管透過性因子が誘導する血管形成およびコラーゲン合成の強力な阻害剤として働きます。VEGF の結合や VEGF 受容体のリン酸化に影響することなく、網膜毛細管内皮細胞における VEGF 刺激および PMA 刺激による PKC 活性を阻害します。また、抗アレルギー性、抗炎症、抗増殖性も有しています。血管平滑筋において Ca^{2+} 動員を誘導します。						
Withaferin A, *Withania somnifera*	5119-48-2	470.6	≥ 94% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	681535-1MG 681535-5MG	21,900 70,000
	細胞透過性のステロイドラクトン。抗腫瘍作用、抗炎症作用、放射線増感作用および免疫抑制作用を示します。ユビキチン媒介性プロテアソーム経路を標的として、血管新生を *in vitro* (HUVEC の増殖に対する IC_{50}=12 nM) と *in vivo* (C57BL/6J マウスにおいて 7 μg/kg/day の皮下注射で 80% の阻害) の両方で強力に阻害し、また、NF-κB の活性化を抑制します (TNF-α 誘導性内皮細胞における IC_{50}=500 nM)。より高い濃度 (約 5 μM) では AP-1 の転写にも影響を与え、細胞死を導きます。						

JAK/STAT Pathway



ATPase/GTPase

ATPase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Amiloride, Hydrochloride	2016-88-8	302.1	≥ 98% by HPLC	room temp.	DMSO (5 mg/ml) or H_2O (2.5 mg/ml)	129876-100MG	12,900
血管新生の阻害剤。約 130 µM の濃度において、毛細管形成を完全かつ可逆的に阻害します。低濃度においては、膜通過 Na^+ 流入および Na^+, K^+-ATPase の強力かつ特異的な阻害剤として作用します。また、ウロキナーゼ型プラスミノーゲン活性化因子 (uPA) の阻害剤としても作用します。収縮刺激に対する平滑筋反応を阻害します。骨格筋におけるパリトキシン誘導性伝導を遮断します。尿細管上皮細胞の膜電位を低下させます。高濃度においては、Na^+/H^+ 交換経路を遮断します。							
Bafilomycin A1, *Streptomyces griseus*	88899-55-2	622.8	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (100 µM) or Ethanol	196000-10UG 196000-1SET	25,000 67,900
マクロライド系抗生物質。液胞型 (V 型) H^+-ATPase の特異的阻害剤として作用します (K_i = 500 pM)。様々なタイプの ATPase を識別するための有用なツールです。マクロファージにおいて、リソソームコレステロールの輸送を遮断します。脳細胞における pH 調節を阻害することが知られています。細胞生存性アッセイにおいて、多数の細胞株に対して細胞毒性作用を示します。アミロイド前駆体タンパク質 (APP) のプロセシングに関与する酵素である β- セクレターゼを選択的に阻害することが報告されています。							
InSolution™ Blebbistatin, Racemic		292.3	≥ 97% by HPLC	-20℃		203389-5MG	42,000
90% の DMSO に (±) - ブレビスタチン (製品番号 203390) の 50 mM (5 mg/342 µl) 溶液。							
(±)-Blebbistatin	674289-55-5	292.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	100% DMSO (100 mg/ml), 90% DMSO (75 mg/ml) or Methanol (1.5 mg/ml)	203390-5MG	39,900
細胞透過性の化合物で非筋肉性ミオシン II の選択的、強力な、可逆性阻害剤。ATPase 活性とヒト血小板の滑動性 (約 100 µM) を阻害します。 myosin light chain kinase (MLCK) 活性は阻害しない。脊椎動物において、cell blebbing をブロックし、細胞の向伸性、運動性を急速に阻害することが知られています。有糸分裂は妨害しません。							
(-)-Blebbistatin		292.3	≥ 98% by Chiral HPLC	-20℃	100% DMSO (100 mg/ml), 90% DMSO (75 mg/ml) or Methanol (1.5 mg/ml)	203391-1MG	32,900
ATPase (IC_{50} = 約 2 µM) およびミオシン II 依存的細胞プロセスに対する阻害活性の原因となる (±) -Blebbistatin (製品番号 203390) の活性エナンチオマー。							
(+)-Blebbistatin		292.3	≥ 98% by Chiral HPLC	-20℃	100% DMSO (100 mg/ml), 90% DMSO (75 mg/ml) or Methanol (1.5 mg/ml)	203392-1MG	26,000
(±) -Blebbistatin (製品番号 203390) の不活性エナンチオマー。活性エナンチオマー (製品番号 203391) のネガティブコントロールとして有用です。							
BTS	1576-37-0	261.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (200 mg/ml)	203895-5MG	22,900
(N-Benzyl-*p*-toluenesulphonamide)							
骨格ミオシン S1 の強力な阻害剤。BTS は Ca^{2+} 刺激 S1 ATP アーゼを阻害し (IC_{50}= 約 5 µM)、滑走運動を可逆的にブロックします。							
Bufalin	465-21-4	386.5	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml) or warm Ethanol (25 mg/ml)	203900-10MG	31,000
[5β, 20(22)-Bufadienolide-3β, 14-diol]							
Bufo 属のヒキガエルから単離された強心性ステロイド。ウアバイン感受性 Na^+, K^+-ATPase 活性を強力に阻害します (IC_{50} = 1.4 nM)。アポトーシス関連遺伝子の発現を変化させることによって、白血病細胞 HL-60 および U937 などの様々なヒト細胞株においてアポトーシスを誘導します。白血病細胞株における p21 活性化キナーゼ (PAK) および c-Jun キナーゼ (JNK) の活性を促進することが報告されています。U937 細胞株において、Tiam1 mRNA 発現の一過性の増加を誘導します (約 100 nM)。ブファリンは、ラット水晶体における細胞内シグナル伝達タンパク質 14-3-3 の遺伝子発現のダウンレギュレーションも誘導します。これは、おそらく Na^+, K^+-ATPase の阻害によるものです。また、ヒト白血病細胞におけるトポイソメラーゼ II のレベルを低下させます。							
2,3-Butanedione 2-Monoxime	57-71-6	101.1	≥ 98% by GC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	203984-500MG	10,900
(BDM)							
骨格筋および心筋の収縮を阻害します。有機リン酸塩によって活性が阻害されたアセチルコリンエステラーゼを脱リン酸化する「化学的フォスファターゼ」です。成熟ラット頸神経節における Ca^{2+} 電流を、可逆的かつ用量依存的に阻害します (IC_{50} = 18.3 nM)。また、イヌ心筋の筋小胞体 (SR) からの Ca^{2+} 放出を誘導することも示されています。							
Calmidazolium Chloride	57265-65-3	687.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or EtOH (10 mg/ml) Note: readily adheres to glass in aqueous solution.	208665-10MG	25,900
(Compound R 24571)							
カルモジュリンアンタゴニスト。脳カルモジュリン依存性フォスフォジエステラーゼの阻害剤として、Trifluoperazine (製品番号 642150) より少なくとも 150 倍強力な活性を有します (IC_{50} = 10 nM)。電位依存性 Ca^{2+} チャネルのブロッカーです。神経芽腫細胞において一酸化窒素の放出を刺激します。また、赤血球中のカルモジュリン依存性 Ca^{2+}-ATPase の強力な阻害剤としても作用します。*in vivo* において心臓の不応期を延長させることが知られています。							
Cyclopiazonic Acid, *Penicillium cyclopium*	18172-33-3	336.4	≥ 97% by TLC	-20℃	Chloroform (10 mg/ml) or DMSO (1 mg/ml)	239805-5MG	15,000
(CPA)							
筋小胞体 Ca^{2+}-ATPase に対する細胞膜透過性の可逆的阻害剤。Thapsigargin (製品番号 586005) と同一の細胞内プールから Ca^{2+} を放出します。培養動脈平滑筋細胞における Ca^{2+} 取り込みを阻害します。また、アクチノマイシン ATPase とは異なる筋小胞体 Ca^{2+}-ATPase を阻害することも知られています。							

ATPase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
BHQ	88-58-4	222.3	≥ 99% by HPLC	room temp.	Ethanol (25 mg/ml), Methanol, or DMSO (1 mM)	286888-100MG	7,000
[*t*-BuBHQ; 2,5-Di-(*t*-butyl)-1,4-hydroquinone]	ミクロソームおよび筋小胞体の Ca^{2+}-ATPase 活性を阻害することによって、Ins(1,4,5)P_3 感受性 Ca^{2+} ストアから特異的に Ca^{2+} を動員します。本品は、ミトコンドリアの Ca^{2+} 流入または原形質膜の Ca^{2+}/Mg^{2+} ATPase 活性には影響を及ぼしません。骨芽細胞様細胞株において、プロスタグランジン E_2 およびプロスタサイクリンの生成を阻害します。						
Eg5 Inhibitor III, Dimethylenastron		302.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	324622-1MG 324622-5MG	22,000 67,000
[7,7-Dimethyl-4-(3-hydroxyphenyl)-5-oxo-3,4,5,6,7,8-hexahydroquinazolin-2(1H)-thione]	細胞透過性のキナゾリンチオン化合物。有糸分裂モーターである Eg5 の微小管刺激 ATP アーゼ活性に対して、強力かつ特異的な可逆性阻害剤として作用します(IC_{50}=200 nM)。キネシン -1、-4、-7 および -10 の ATP アーゼ活性に対してはほとんど効果を示さず、Monastrol(製品番号 475879)よりも約 100 倍強力です。また、HeLa 細胞とアフリカツメガエル卵抽出液の両方において二極性紡錘糸形成を阻害し、細胞周期の停止を誘導します(約 1 μM)。ヒト多発性骨髄腫細胞において有糸分裂の停止とアポトーシスを誘導し、Hsp70 をアップレギュレートすることが示されています。						
Eg5 Inhibitor IV, VS-83	909250-29-9	274.3	≥ 99% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	324623-5MG	56,000
[5-Fluoro-3,4-dihydro-4(3'-hydroxyphenyl) quinazoline-2(1H)-thione; Vasastrol]	細胞透過性の Monastrol(製品番号 475879)アナログ。9 キネシンパネルにおいて有糸分裂キネシン Eg5-ATPase 活性を強力かつ選択的に阻害します(Vasastrol および Monastrol に対する IC_{50} = 1.17 μM および 20.73 μM)。BSC-1 細胞において単極紡錘体形成を誘導し(Vasastrol および Monastrol に対する EC_{50} = 7.27 μM および 58.74 μM)、β- アクチンおよびチューブリンの配列にはほとんど影響を与えません。ヒト神経膠芽細胞において増殖抑制作用を示すことが知られています。						
Eg5 Inhibitor VI		316.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml) or Ethanol (15 mg/ml)	324629-5MG	35,100
	抗腫瘍作用を示す細胞透過性のビフェニルスルファミド化合物。Eg5/KSP の強力な可逆的かつ ATP 競合的な阻害剤として作用し(WT-KSP および D130V-KSP における IC_{50} = 18 nM ; K_i = 6.2 nM および 7 nM)、結腸直腸がん増殖を抑制します(HCT116、HCT116-D130V および Colo205 細胞における IC_{50} = 403 nM、5.4 nM および 181 nM)。						
Eg5 Inhibitor VII		291.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	324631-5MG	34,900
	細胞透過性のキノリノン化合物。アロステリック部位を介した ATP 結合の拮抗作用によって非常に強力かつ選択的な Eg5/KSP 阻害剤として作用します(変異型 A133D、KHC-L5、D130V、野生型 KSP に対する K_i = 1.4、2.1、2.2、1.7 nM)。卵巣腺がん SKOV3 細胞において単極紡錘体を強力に誘導し、結腸直腸がん HCT116 細胞の増殖を阻害します(親および ispinesib 耐性 D130V 変異株に対する IC_{50} = 36 および 0.5 nM)。微小管に関して非競合的で、7 種類の他の有糸分裂キネシンのパネルに対してはほとんど作用を示しません。						
N-Ethylmaleimide	128-53-0	125.1	> 96% by GC	room temp.	Ethanol (5 mg/ml)	34115-5GM	12,900
(NEM)	スルフォヒドリルアルキル化試薬。NADP 依存性イソクエン酸デヒドロゲナーゼを不活化します。エンドヌクレアーゼ阻害剤です。また、ラット肝臓核において、Mg^{2+} 刺激および Ca^{2+}/Mg^{2+} 刺激による DNA 断片化を強力に阻害します。内皮細胞において、PLA_2 の活性化によってアラキドン酸の遊離を促進します。						
Folimycin, *Streptomyces sp.*	80890-47-7	866.1	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO. Further dilute with aqueous buffers just prior to use.	344085-10UG	24,900
(Concanamycin A)	液胞型 H^+-ATPase(V- 型)の高感度かつ高特異性阻害剤(K_i = 20 pM)。リソソームおよびゴルジ装置などのオルガネラの酸性化を阻害します。また、ウイルスエンベロープの糖タンパク質の表面発現を阻害しますが、その合成は阻害しません。細胞内タンパク質転座の研究に有用です。細胞生存率分析において、数多くの細胞株に対して細胞毒性を示します。細胞傷害性 T 細胞(CTL)のパーフォリン依存性細胞傷害活性を特異的に阻害し、Fas リガンド依存性の細胞傷害活性を阻害しない。						
Fumitremorgin C, *Aspergillus. fumigatus*	118974-02-0	379.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	344847-250UG	43,900
(FTC; NSC719655)	細胞透過性のインドリルジケトピペラジニル系マイコトキシン。BCRP/ABCG2(乳がん耐性タンパク質 /ATP 結合カセット G2)多剤耐性トランスポート活性を阻害し、強力かつ特異的な化学増感剤として作用します。						
4-Hydroxynonenal	75899-68-2	156.2	≥ 98% by HPLC	-70℃	Ethanol (10 mg/ml)	393204-1MG	10,000
(HNE; 4-Hydroxy-2-nonenal)	ω-6- 不飽和脂肪酸の過酸化により形成される主要アルデヒド産物。脂質過酸化の特異的指標とみなされています。HL-60 ヒト白血病細胞の増殖を阻害し、分化を誘導します。また、マウス肺胞マクロファージおよび PC12 細胞の細胞死を誘導します。μM レベルで呼吸第 3 相を阻害します。細胞質 Ca^{2+} の一過的上昇を引き起こし、Na^+, K^+-ATPase 活性を不可逆的に阻害します(IC_{50} = 120 μM)。c-Jun N 末端キナーゼ(JNK)の可逆的阻害剤として作用します。						
Mastoparan	72093-21-1	1478.9	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O (5 mg/ml)	444898-1MG	31,000
(INLKALAALAKKIL)	*Vespula lewisii* と同一の配列をもつ細胞浸透性合成ペプチド。G タンパク質共役受容体と類似した機構によって、百日咳毒素感受性 G タンパク質の直接的活性化が可能な、両親媒性アシナガバチ毒素 14 アミノ酸ペプチドです。G_s よりも G_i および G_o に対して選択的に作用します。ミトコンドリア膜透過性亢進を示すポアを強力に促進します。カルモジュリンアンタゴニストとしても作用し、フォスフォリパーゼ A_2 を活性化します。筋小胞体からの Ca^{2+} の一時的放出を引き起こします。また、Na^+, K^+-ATPase 活性の阻害も報告されています(IC_{50} = 7.5 μM)。						
Monastrol	254753-54-3	292.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	475879-1MG 475879-5MG	18,900 54,900
[4-(3-Hydroxyphenyl)-6-methyl-2-thioxo-1,2,3,4-tetrahydro-4H-pyrimidin-5-carboxylic Acid Ethyl Ester]	細胞浸透性で、チューブリンと相互作用しない強力な有糸分裂阻害剤。哺乳類細胞の有糸分裂を単極の紡錘体で停止させます。*in vitro* で有糸分裂キネシン Eg5 の運動性を特異的に阻害します。Eg5 は有糸分裂紡錘体の組立てと維持に関係するモータータンパク質です(IC_{50} = 14 μM)。						
Oligomycin	1404-19-9	791.1	≥ 90% by HPLC (mixture of A, B, and C isomers)	room temp.	Ethanol (250 mg/ml)	495455-10MG	16,900
	A、B および C 異性体の混合品。膜結合型ミトコンドリア ATP アーゼ(F_1)を阻害し、フォスフォリル基の転移を防ぐマクロライド系抗生物質。培養ヒトリンパ芽および他の哺乳類細胞でアポトーシスを誘導します。						
Omeprazole	73590-58-6	345.4	≥ 99% by TLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	496100-50MG	24,900
{H 168/68; 5-Methoxy-2[(4-methoxy-3,5-dimethyl-2-pyridyl) methylsulfinyl]-1H-benzimidazole}	選択的なプロトンポンプ阻害剤として作用する細胞浸透性のピリジル・メチルスルフィニル・ベンゾイミダゾール化合物。						

ATPase/GTPase

ATPase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Ouabain, Octahydrate (Strophanthin G)	11018-89-6	728.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O (10 mg/ml)	4995-1GM	19,000
Na⁺, K⁺-ATPase を阻害。また、強心性を示します。腫瘍細胞における放射性毒性を特に高め、照射誘導性の G_2 遅延を長引かせることでアポトーシスを誘導します。							
Phorbol-12,13-dibutyrate (PDBu)	37558-16-0	504.6	≥ 99% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) . Further dilute with aqueous buffers just prior to use.	524390-1MG 524390-5MG	13,000 35,000
マウスの皮膚に対する強力な刺激物質ですが、腫瘍プロモーター活性はわずかです。プロテインキナーゼ C を活性化します。Na⁺, K⁺-ATPase のリン酸化を促進してその活性を阻害します。肝細胞培養において誘導可能 NOS の発現を促進します。結合試験あるいは高濃度のフォルボール化合物を要する場合に広く使用されています。							
Suramin, Sodium Salt	129-46-4	1429.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	H_2O (5 mg/ml)	574625-50MG 574625-200MG	10,900 33,000
抗腫瘍剤、抗血管新生剤。おそらく、細胞内受容体ドメインとの相互作用をブロックすることによって、受容体から G タンパク質を外すものと思われます。G_{α}- サブユニット活性化の律速段階である GDP-GTP 交換を阻害します。逆転写酵素の競合的阻害剤。トポイソメラーゼ I および II を阻害することが報告されています。筋小胞体膜の Ca^{2+}-ATP アーゼを阻害します。また、EGF, PDGF, TGF-β など、さまざまな増殖因子の細胞表面結合を阻害。フォスフォリパーゼ D も阻害します (IC_{50} = 15 μM)。ATP 結合酵素および P_2 プリン受容体と相互作用することが報告されています。血管抑制ステロイドと併用した場合、カルモジュリンアッセイにおいて血管新生を効果的に阻害します。また、プロテインチロシンフォスファターゼの可逆的かつ競合的な阻害剤としても有用です。							
Thapsigargin	67526-95-8	650.8	≥ 97% by TLC	-20℃	DMSO (>1 mg/ml) or ethanol (5 mg/ml)	586005-1MG	14,000
小胞体 Ca^{2+}-ATPase を阻害 (IC_{50} = 4-13 nM) することによって、Ca^{2+} を放出する細胞浸透性の発がん促進性セスキテルペン・ラクトン。イノシトールリン酸を増加させず、プロテインキナーゼ C に対しても有意な影響を示しません。ヒト血小板における Ca^{2+} 依存的 Na^+ 流入を用量依存的に増加します。また、ラット胸腺細胞およびヒト肝臓がん細胞でアポトーシスを誘導します。							
V-ATPase Inhibitor, KM91104 H⁺-ATPase Inhibitor		272.08	>95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	672999-10MG	21,900
V-ATPase (IC_{50} = 2.3 μM)、*in vitro* の a3-b2 サブユニットタンパク質間相互作用を特異的に標的にする、細胞透過性、非マクロライド小分子 V-ATPase 阻害剤。また、RAW 264.7 細胞の生存能力や RANKL 介在破骨細胞分化に大きな影響を及ぼすことなく、*in vitro* 破骨細胞モデル、RANKL 分化 RAW 264.7 細胞の合成ヒドロキシアパタイトの表面とデンチンスライスにおいて破骨細胞性吸収 (IC_{50} of 1.2 μM) を阻害することも示されています。							

GTPase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Dynamin Inhibitor I, Dynasore [3-Hydroxynaphthalene-2-carboxylic acid-(3,4-dihydroxybenzylidine)-hydrazide; Sore to Dynamin]	304448-55-3	322.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (16 mg/ml)	324410-10MG	19,000
細胞透過性のセミカルバゾン化合物。ダイナミン GTPase 活性を強力、特異的、迅速、可逆的かつ非競合的に阻害します (IC_{50} = 約 15 μM)。ダイナミン依存性のエンドサイトーシスおよびクラスリン被覆小胞の出芽を抑制し、クラスリンの取り込みを阻害し、クラスリンピット形成を遅延させることが示されています。							
Dynamin Inhibitor II, MiTMAB (Myristyltrimethylammonium Bromide; Tetradecyltrimethylammonium Bromide; TTAB)	1119-97-7	336.4	≥ 99% by Titration	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or H_2O (100 mg/ml)	324411-500MG	13,900
ダイナミン GTPase 活性の可逆的阻害剤。細胞透過性で陽イオン界面活性剤です。PH ドメインを標的としてリン脂質結合を阻害することによってダイナミン GTPase 活性を可逆的に阻害します (IC_{50} = 3.15 μM)。ラット脳シナプトソームにおいてダイナミン I 依存性 SVE (シナプス小胞エンドサイトーシス) を抑制し、非神経 HeLa, A431 および COS-7 細胞においてダイナミン II 依存性 RME (受容体媒介エンドサイトーシス) を抑制することが知られています。阻害は PS に関して競合的、GTP に関して非競合的です。							
Dynamin Inhibitor III, Phthaladyn-23 4-Chloro-2-((2-(3-nitrophenyl)-1,3-dioxo-2,3-dihydro-1H-isoindole-5-carbonyl)-amino)-benzoic acid		465.8	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (7 mg/ml)	324412-10MG	20,000
GTP 競合的にダイナミン GTPase 活性 (IC_{50} = それぞれ 17.4 ならびに 63 μM、精製羊脳ダイナミン I ならびに組換えダイナミン II) を阻害することが報告されている細胞透過性 phthalimide 化合物。ラット脳シナプトソーム (IC_{50} = 12.9 μM) への FM4-64 染料の K+ 誘発性 SVE (シナプス小胞エンドサイトーシス) をブロッキングすることが認められていますが、一方でヒト骨肉種上皮 U2OS 細胞におけるトランスフェリンの RME (受容体介在エンドサイトーシス) に対して 30 μM 時に無効になります。これは、おそらくダイナミン II の阻害有効性が低いのか、急激な放出のせいか、細胞株の透過性が限定的なせいかのどれか、またはすべてが原因と思われます。							
Dynamin Inhibitor IV, Hydroxy-Dynasore		338.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	324413-10MG	35,000
Dynamin Inhibitor V, 34-2		408.6	≥ 99% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	324414-10MG	29,000
Rac1 Inhibitor (NSC23766)		530.96	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O (5 mg/ml)	553502-5MG 553502-10MG	19,000 34,000
細胞透過性のピリミジン化合物。Rac1 と Rac 特異的 GEF (グアニンヌクレオチド交換因子) Trio および Tiam1 との相互作用を阻害する (IC_{50} 50 μM) ことによって、Rac1 の GDP/FTP 交換活性を特異的に阻害します。NIH3T3 細胞および PC-3 細胞において Rac1 を介した細胞機能を強力に抑制することが明らかになっています (有効量 約 50 -100 μM)。Cdc42 または RhoA の活性化に対しては作用を示しません。また、Rac1 と BcrGAP または PAK1 との相互作用にも影響を与えません。							
InSolution™ Rac1 Inhibitor		531	≥ 93% by HPLC	-20℃		553508-5MG	66,900
Rac1 阻害剤 (製品番号 553502) の 50 mM (5 mg/185 μl) 水溶液。							
Rac1 Inhibitor II		415.5	≥ 93% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	553511-10MG	15,900
細胞 Cdc42 や RhoA 活性、あるいはエフェクター Pak1 への Rac1 相互作用に対して影響がない一方、Rac1 と Tiam1 との相互作用を干渉することによって血清飢餓 SMC における PDGF-BB- (製品番号 521225) 誘発の細胞 Rac1 活性を阻害することにおいて、より効果的な細胞透過性のイソオキサゾリルベンズアミド化合物。 PDGF-BB 誘発性膜ラフリングと血清飢餓 3T3 細胞 (25 μM で 4 h の下処理) における葉状仮足生成を効果的に防ぐことを示しています。							
InSolution Rac1 Inhibitor II, Z62954982	1090893-12-1	415.5	≥ 93% by HPLC	-20℃		553512-10MG	28,900
Trio N-Terminal RhoGEF Domain Inhibitor, ITX3 (2E)-(-2-((2,5-Dimethyl-1-phenyl-pyrrol-3-yl) methylene) thiazolo[3,2-a]benzimidazol-1-one	347323-96-0	371.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (2 mg/ml)	645890-10MG	15,000
トリオ N 末端 RhoGEF ドメイン (TrioN) 介在 RhoG 活性 (IC_{50} = 76 μM) を阻害し、HEK293T 細胞の過剰発現と、GEF337 (RhoA GEF)、Tiam1 (Rac GEF) あるいは Vav2 (Rac1/RhoA/Cdc42 GEF) ではなく TrioN によって、HEK293T 細胞の過剰発現と細胞 Rac 活性 (by 80% with 50 μM ITX3) を効果的に低減する細胞透過性チアゾロ - ベンズイミダゾロン化合物。 トリオノックダウン C2C12 細胞における分化に関連したミオゲニンならびにトロポニン T 発現は同じ濃度で ITX によって影響が及ばない一方、100 μM での ITX の培養処理はラット PC12 褐色細胞腫細胞の NGF 誘発性神経突起伸長を 50%低減し、分化により誘発された C2C12 マウス筋芽細胞培養における多核筋管の形成を 78%ブロッキングすることが示されています。							

アポトーシス・ネクローシス

Autophagy

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
MDMX Antagonist, SJ-172550	431979-47-4	428.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	444155-10MG	33,000
Spautin-1		271.26	≥ 99% by HPLC	+4℃	DMSO	567569-10MG	38,900

Caspase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Caspase-9 Inhibitor III		587	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or (1 mg/ml) H_2O	218728-1MG	24,900
(Ac-LEHD-CMK)	カスパーゼ -9 に対する強力な不可逆的阻害剤。						
Caspase Inhibitor VIII		543.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218729-1MG	27,000
(Ac-VDVAD-CHO)	カスパーゼ -2 (K_i = 3.5 nM)、カスパーゼ -3 (K_i = 1.0 nM) およびカスパーゼ -7 (K_i = 7.5 nM) に対する強力な可逆的阻害剤。DRONC (*Drosophila* カスパーゼ)、グルタミン酸 / アスパラギン酸プロテアーゼの阻害剤としても使用することができます。						
Caspase Inhibitor II		329.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (150 mg/ml)	218735-1MG	16,000
(Ac-VAD-CHO)	カスパーゼ -1 (ICE)、カスパーゼ -3、カスパーゼ -4、およびカスパーゼ -7 に対する強力な可逆的阻害剤です。						
Caspase Inhibitor I, Biotin Conjugate		672.8	single spot by TLC	-20℃	DMSO (20 mM)	218742-1MG	93,000
(Biotin-X-VAD-FMK)	Caspase Inhibitor I (製品番号 627610) のビオチン化誘導体です。						
Caspase-2 Inhibitor I		695.7	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218744-250UG 218744-1MG	30,900 84,900
(Z-VDVAD-FMK)	カスパーゼ -2 (ICH-1) の不可逆的阻害剤。						
Caspase Inhibitor III		263.3	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218745-250UG 218745-1MG	15,900 37,900
(Boc-D-FMK)	作用スペクトルの広い、細胞膜透過性の不可逆的カスパーゼ阻害剤です。						
Caspase-1 Inhibitor VI		630.7	single spot by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218746-250UG 218746-1MG	25,900 68,900
(Z-YVAD-FMK)	カスパーゼ -1 (ICE) およびカスパーゼ -4 に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤。						
Caspase-3 Inhibitor III		551	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	218750-1MG 218750-5MG	19,900 67,900
(Ac-DEVD-CMK)	カスパーゼ -3、カスパーゼ -6、カスパーゼ -7、カスパーゼ -8、およびカスパーゼ -10 に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤。						
Caspase-5 Inhibitor I		763.8	single spot by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218753-1MG	84,000
(Z-WEHD-FMK)	カスパーゼ -5 (ICE_{rel}-III, TY)、カスパーゼ -1、およびカスパーゼ -4 に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤。						
Caspase-4 Inhibitor I		500.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	218755-1MG	16,000
(Ac-LEVD-CHO)	カスパーゼ -4 (ICH-2) の阻害剤。						
Caspase-6 Inhibitor I		652.7	≥ 90% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218757-250UG 218757-1MG	25,000 67,000
[Z-VE(OMe)ID(OMe)-FMK]	カスパーゼ -6 (Mch2) の不可逆的阻害剤。						
Caspase-8 Inhibitor II		654.7	single spot by TLC	-20℃	DMSO (10 mM)	218759-250UG 218759-1MG	24,900 55,000
[Granzyme B Inhibitor III; Z-IE(OMe)TD(OMe)-FMK]	カスパーゼ -8 (FLICE, MACH, Mch5) に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤。HeLa 細胞におけるインフルエンザウイルス誘導性アポトーシスを強力に阻害します。グランザイム B に対する阻害作用も示します。						
Caspase-9 Inhibitor I		690.7	single spot by TLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	218761-250UG 218761-1MG	30,900 67,000
[Z-LE(OMe)HD(OMe)-FMK]	カスパーゼ -9 (ICE-LAP6, Mch6) に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤。カスパーゼ -4 およびカスパーゼ -5 に対しても阻害作用を示します。						
Caspase-4 Inhibitor I, Cell-Permeable		1998.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218766-1MG	44,900
(LEVD-CHO, Cell-permeable; sequence)	カスパーゼ -4 (ICE_{rel}-II, TX, ICH-2) に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する可逆的阻害剤。N 末端配列 (アミノ酸残基 1-16 番) は、カポジ線維芽細胞成長因子のシグナルペプチドの疎水性領域に対応しており、ペプチドに細胞膜透過性を与える役割を果たしています。						
Caspase-6 Inhibitor II, Cell-Permeable		1998.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218767-1MG	46,900
(VEID-CHO, Cell-permeable; sequence)	カスパーゼ -6 (Mch2) に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する可逆的阻害剤。N 末端配列 (アミノ酸残基 1-16 番) は、カポジ線維芽細胞成長因子のシグナルペプチドの疎水性領域に対応しており、ペプチドに細胞膜透過性を与える役割を果たしています。						
Caspase-8 Inhibitor I, Cell-Permeable		2000.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218773-1MG	46,900
(Granzyme B Inhibitor II, Cell-permeable; IETD-CHO, Cell-permeable)	カスパーゼ -8 (FLICE, MACH, Mch5) およびグランザイム B に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する可逆的阻害剤。N 末端配列 (アミノ酸残基 1-16 番) は、カポジ線維芽細胞成長因子のシグナルペプチドの疎水性領域に対応しており、ペプチドに細胞膜透過性を与える役割を果たしています。						

アポトーシス・ネクローシス

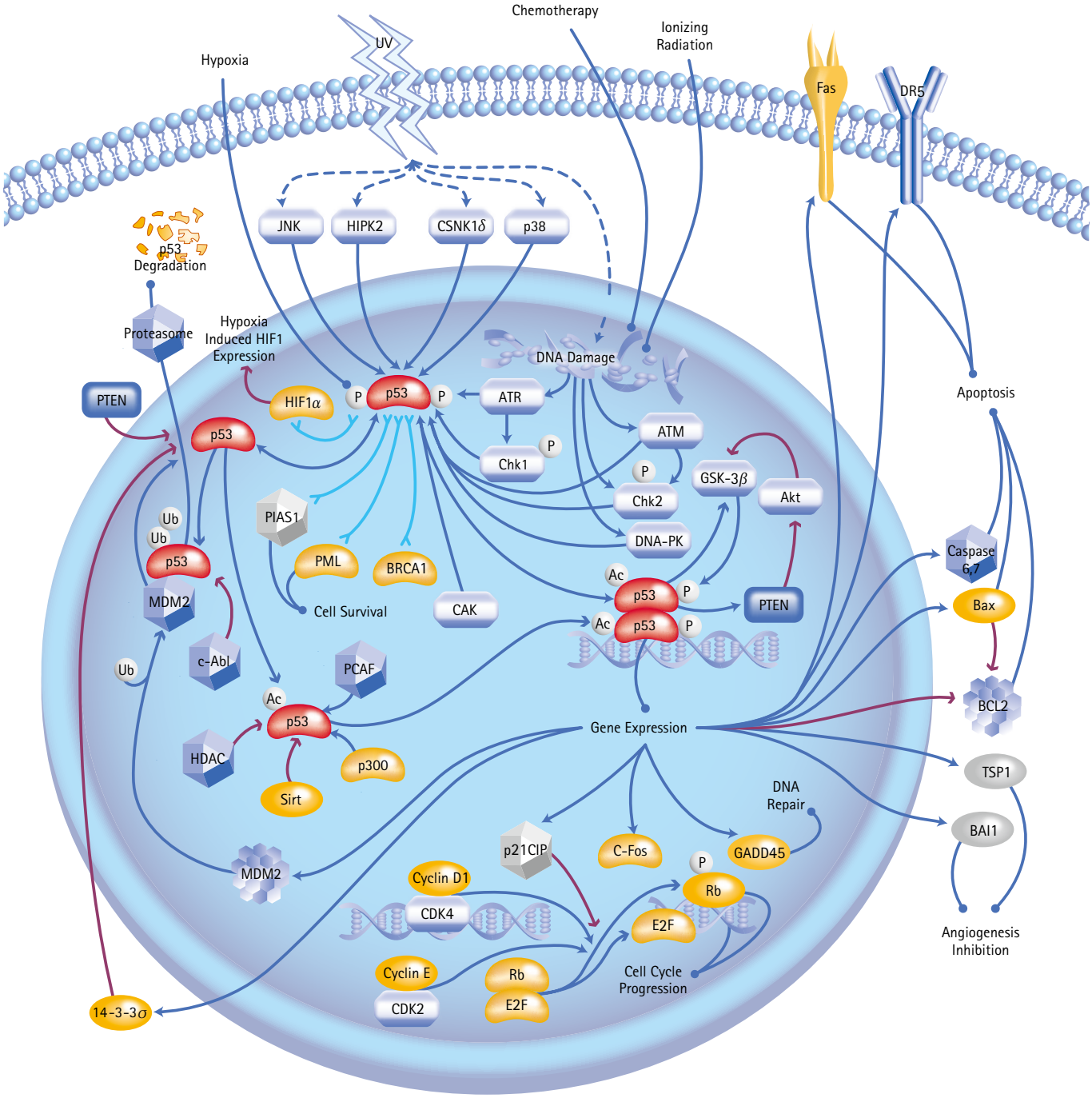
Caspase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Caspase-9 Inhibitor II, Cell-Permeable		2036.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218776-1MG	46,900
(LEHD-CHO, Cell-permeable)	カスパーゼ -9 (ICE-LAP6, Mch6) に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する可逆的阻害剤です。本品は、カスパーゼ -4 およびカスパーゼ -5 に対しても阻害作用を示します。N 末端配列 (アミノ酸残基 1-16 番) は、カポジ線維芽細胞成長因子のシグナルペプチドの疎水性領域に対応しており、ペプチドに細胞膜透過性を与える役割を果たしています。						
Caspase-3/7 Inhibitor I		324.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml) or Methanol (10 mg/ml)	218826-1MG	27,900
{5-[(S)-(+)-2-(Methoxymethyl) pyrrolidino] sulfonylisatin}	カスパーゼ -3 (K_i = 60 nM) およびカスパーゼ -7 (K_i = 170 nM) に対する強力な可逆的非ペプチド阻害剤。カスパーゼ -9 に対しても弱い阻害作用を示します (K_i = 3.1 µM) が、カスパーゼ -1、-2、-4、-6、および -8 に対してはほとんど阻害活性を示しません (K_i > 25 µM)。						
Caspase Inhibitor II, Cell-Permeable		1827.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	218830-1MG	45,900
(cpm-VAD-CHO; sequence)	細胞膜透過性の可逆的汎カスパーゼ阻害剤。カポジ線維芽細胞成長因子シグナル伝達ペプチドの N 末端配列 (アミノ酸残基 1-16 番) を結合することによって産生されます。この N 末端配列は、VAD ペプチドに細胞膜透過性を与える役割を果たしています。						
Caspase-3/7 Inhibitor II		501.5	Single main spot with additional trace spot by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	218832-1MG	25,900
(Ac-DNLD-CHO)	カスパーゼ 3 および 7 (それぞれ IC_{50} = 3.2 nM および 22.6 nM) の強力かつ可逆的な活性部位結合阻害剤として働くテトラペプチジルアルデヒド。カスパーゼ 8 および 9 に対するよりも、約 100 倍高い選択性を示します (それぞれ IC_{50} = 577.6 nM および 364.7 nM)。Camptothecin (製品番号 208925) および Jurkat T 細胞における抗 Fas 媒介性アポトーシスに対して抵抗性を示します。						
InSolution™ Caspase-8 Inhibitor II		654.7	single spot by TLC	-20℃		218840-250UG	25,900
[Granzyme B Inhibitor III; Z-IE(OMe)TD(OMe)-FMK]	Z-IETD-FMK (製品番号 218759) の 5 mM DMSO 溶液 (250 µg/76 µl)。						
InSolution™ Caspase-9 Inhibitor I		690.7	single spot by TLC	-20℃		218841-250UG	32,900
[Z-LE(OMe)HD(OMe)-FMK]	Z-LEHD-FMK (製品番号 218761) の 5 mM DMSO 溶液。						
Caspase-3 Inhibitor V		685.7	single spot by TLC	-20℃	DMSO (20 mM)	219002-1MG	57,000
[Z-D(OMe)QMD(OMe)-FMK]	カスパーゼ -3 に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤。						
Caspase Inhibitor VI		453.5	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (9 mg/ml)	219007-250UG 219007-1MG	17,900 40,000
(Z-VAD-FMK)	不可逆的な全般的カスパーゼ阻害剤。組換え、単離、精製カスパーゼ酵素の研究に有用です。本品は、Caspase Inhibitor I (製品番号 627610) とは異なり、*in vitro* 試験においてエステラーゼによる前処理を必要としません。						
InSolution™ Caspase Inhibitor VI		453.5	≥ 95% by TLC	-20℃		219011-1MG	52,900
	Caspase Inhibitor VI (製品番号 219007) の 10 mM (1 mg/221 µl) DMSO 溶液です。						
Caspase-3 Inhibitor VIII		364.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) . Fresh, anhydrous DMSO is recommended.	219013-10MG	28,000
N-Benzyloxycarbonyl-(S)-tert-butyl-Leu-Asp-Aldehyde	細胞透過性のジペプチジルアスパラギン酸アルデヒド。可逆的かつ基質競合的に caspase-3 活性を強力に阻害します (K_i^0 = 3.6 nM)。Z-tLeu-Asp-H は、0.43 nM 以上の濃度において、ヒト DLD-1 結腸腺癌細胞におけるビタミン E 誘導性 PARP 切断を完全阻害することが判明している一方、上流に位置する各種 caspase による caspase-3 の活性化には影響しません。						
Caspase-3 Inhibitor I		502.5	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O	235420-1MG 235420-5MG	19,900 69,900
(Ac-DEVD-CHO; CPP32/Apopain Inhibitor)	カスパーゼ -3 (IC_{50} = 200 pM)、カスパーゼ -6、カスパーゼ -7、カスパーゼ -8、およびカスパーゼ -10 に対する、極めて強力かつ特異的な可逆的阻害剤です。ペプチド含量ベースでの販売となります。						
Caspase-3 Inhibitor IV		533.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O	235421-1MG 235421-5MG	24,900 73,000
(Ac-DMQD-CHO)	カスパーゼ -3 の特異的阻害剤。このテトラペプチドは、Fas 刺激 Jurkat 細胞におけるカスパーゼ活性化経路の遮断を目的として、カスパーゼ -6 阻害剤 Ac-VEID-CHO と併用されています。						

Caspase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Caspase-3 Inhibitor I, Cell-Permeable		2000.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	235423-1MG	41,000
(Cell-permeable, DEVD-CHO; CPP32/Apopain Inhibitor, Cell-permeable)	カスパーゼ -3、カスパーゼ -6、カスパーゼ -7、カスパーゼ -8、およびカスパーゼ -10 の細胞膜透過性阻害剤。このペプチドの C 末端 DEVD-CHO 配列は、カスパーゼ -3 に対して特異性の高い強力な可逆的阻害作用を示し（K_i < 1 nM）、培養ヒト骨肉腫細胞抽出液における PARP 切断を強力に阻害することも示されています（IC_{50} = 200 pM）。N 末端配列（アミノ酸残基 1-16 番）は、カボジ線維芽細胞成長因子（K-FGF）のシグナルペプチドの疎水性領域（h- 領域）に対応しており、ペプチドに細胞膜透過性を与える役割を果たしています。ペプチド含量ベースでの販売となります。						
InSolution™ Caspase-3 Inhibitor I, Cell-Permeable		2000.4	≥ 90% by HPLC	-20℃		235427-1MG	42,900
(Cell-permeable, DEVD-CHO; CPP32/Apopain Inhibitor, Cell-permeable)	DMSO に細胞透過性カスパーゼ -3 阻害剤 I（製品番号 235423）の 5 mM（1 mg/100 µl）溶液。						
Caspase-3 Inhibitor II		668.7	≥ 90% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	264155-250UG	21,900
						264155-1MG	62,900
[Z-D(OMe)E(Ome)VD(OMe)-FMK]	カスパーゼ -3、カスパーゼ -6、カスパーゼ -7、カスパーゼ -8、およびカスパーゼ -10 に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤。						
InSolution™ Caspase-3 Inhibitor II		668.7	single spot by TLC	-20℃		264156-250UG	24,900
[Z-D(OMe)E(Ome)VD(OMe)-FMK]	Z-DEVD-FMK（製品番号 264155）の 5 mM DMSO 溶液（250 µg/75 µl）。						
Caspase Modulator I, 1541		411.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	264157-10MG	25,000
Caspase-6 Inhibitor XI, Procaspase-3 Activator II, Procaspase-6 Activator I, 8-Methoxy-2-oxo-2H-chromene-3-carboxylic acid-(3-imidazo[1,2-a] pyridin-2-yl-phenyl)-amide, Caspase-3 Inhibitor XV	大小両方のサブユニット活性部位を標的にすることで、カスパーゼ -3 とカスパーゼ -6 活性（IC_{50} = それぞれ 35 38 µM）を阻害する細胞透過性 phenylimidazopyridinyl- メトキシクマリン化合物。1541 とその 8- ヒドルキシ類似体（製品番号 529663）のキナーゼ研究では、準最適阻害剤の酵素前駆体モル比（100:1 以下）で、その化合物はプロカスパーゼ -3 と -6（EC_{50} = それぞれ 2.4 ならびに 2.8 µM）の非占有の活性部位を通じてそれに続く自己タンパク質分解あるいは自己活性化を促進させる「オン状態の」配列において酵素前駆体の活性部位を効果的に占有しながら安定させることはできない、ということを示しています。カスパーゼ 3 依存性、p53、カスパーゼ 8、Bak 非依存性において様々ながん細胞株（3.8 ~ 8.7 µM の範囲で IC_{50}）で効果的にアポトーシス（最大 50 µM）を誘発することを示しています。50 µM もの濃度においても活性カスパーゼ 7（30 nM）に対して阻害効果はほとんど無いことを示しています。また、それぞれ 4h と 24h の長時間培養後でさえも活性プロカスパーゼ 1 あるいは 7 に対しても阻害効果はほとんどありません。						
Caspase Inhibitor, Negative Control	96922-64-4	386.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	342000-1MG	22,000
						342000-5MG	81,000
(Cathepsin B, Inhibitor I; Z-FA-FMK)	カテプシン B 阻害剤。カスパーゼ -1 阻害剤のネガティブコントロールに適しています。						
Group III Caspase Inhibitor I		610.6	Single spot by TLC	-20℃	DMSO (20 mM)	368620-1MG	71,000
[Z-AE(OMe)VD(OMe)-FMK]	グループ III カスパーゼ（カスパーゼ 6、8、9 および 10）の強力な細胞浸透性かつ不可逆的阻害剤。カスパーゼ 6 および 8 に対してより強力に作用します。						
Caspase-1 Inhibitor I		492.5	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O	400010-1MG	17,900
						400010-5MG	64,000
[IL-1β Converting Enzyme (ICE) Inhibitor I; L-709049; Ac-YVAD-CHO]	カスパーゼ -1（K_i = 200 pM for human recombinant caspase-1）およびカスパーゼ -4 に対する強力かつ特異的な可逆的阻害剤。L929-APO-1 細胞において、抗 APO-1 抗体誘導性アポトーシスを強力に阻害します。						

p53 Signaling



阻害剤関連製品の最新情報はこちらから >> www.merckmillipore.jp/sogaizai

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

アポトーシス・ネクローシス

Caspase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Caspase-1 Inhibitor I, Cell-Permeable		1990.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml)	400011-1MG	44,900
(Ac-AAVALLPAVLLALLAPYVAD-CHO; ICE Inhibitor I, Cell-permeable; YVAD-CHO, Cell-permeable)	カスパーゼ -1 (ICE; インターロイキン -1β 変換酵素) およびカスパーゼ -4 の細胞膜透過性阻害剤。このペプチドの C 末端 YVAD-CHO 配列は、カスパーゼ -1 に対して特異性の高い強力な可逆的阻害作用を示します (K_i = 1 nM)。N 末端配列 (アミノ酸残基 1-16 番) は、カポジ線維芽細胞成長因子 (K-FGF) のシグナルペプチドの疎水性領域 (h- 領域) に対応しており、ペプチドに細胞膜透過性を与える役割を果たしています。						
Caspase-1 Inhibitor II	178603-78-6	541	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	400012-5MG	27,000
[IL-1β Converting Enzyme (ICE) Inhibitor II; Ac-YVAD-CMK]	カスパーゼ -1 (K_i = 760 pM) およびカスパーゼ -4 に対する細胞膜透過性の不可逆的阻害剤。Fas を介したアポトーシスおよび酸性スフィンゴミエリナーゼの活性化を阻害します。						
Caspase-1 Inhibitor IV		654.7	≥ 96% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	400015-1MG	26,900
(Ac-YVAD-AOM; ICE Inhibitor IV)	カスパーゼ -1 およびカスパーゼ -4 に対する、選択性の高い競合的な不可逆的阻害剤。本品は、拡散によって律速された酵素を不活化し、グルタチオンなどの他の生体求核剤に対しては比較的活性が弱いため、*in vivo* 酵素阻害試験用として優れた物質です。						
InSolution™ Q-VD-OPh, Non-O-methylated		513.8	≥ 90% by TLC	-20℃		551476-1MG 551476-5MG	38,900 145,000
[N-(2-Quinolyl)valyl-aspartyl-(2,6-difluorophenoxy)methyl Ketone]	作用スペクトルの広い細胞透過性の不可逆的カスパーゼ阻害剤 [IC_{50} = 50 nM (カスパーゼ -1)、100 nM (カスパーゼ -8)、430 nM (カスパーゼ -9)、< 25 nM (カスパーゼ -3)]。カスパーゼを介したすべての主要な細胞アポトーシス経路 (カスパーゼ 9/3、カスパーゼ 8/10、およびカスパーゼ 12) に対して強力な抗アポトーシス作用を示します。極めて高濃度でも細胞毒性作用を示しません。ペプチドの疎水性を低下させ、水性媒質中での使用を容易にするために、アスパルチル残基をメチル化していません。						
InSolution™ Caspase Inhibitor I		467.5	Single spot by TLC	-20℃		627609-1MG	51,000
[Z-VAD (OMe)-FMK]	カスパーゼ -1 阻害剤 I (製品番号 627610) の 5 mM (1 mg/100 µl) DMSO 溶液。						
Caspase Inhibitor I		467.5	Single spot by TLC	-20℃	DMSO (50 mM)	627610-1MG 627610-5MG	48,900 90,900
[Z-VAD (OMe)-FMK]	カスパーゼ (カスパーゼ -1、カスパーゼ -3、カスパーゼ -4、カスパーゼ -7 など) に対する、特異性が高く細胞膜透過性を有する不可逆的阻害剤。Jurkat 細胞における Fas を介したアポトーシスおよび角膜上皮細胞におけるスタウロスポリン誘導性細胞死を阻害します。カスパーゼ -3 の活性型へのプロセシングを抑制します。*in vitro* 試験に使用するためには、エステラーゼによる前処理が必要です。						

FTase, GGTase, メチルトランスフェラーゼ 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Benzyl-2-acetamido-2-deoxy-α-D-galactopyranoside	3554-93-6	311.3	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) or Hot Ethanol (1 mg/ml)	200100-100MG	31,900
(Benzyl-α-GalNAc)	様々な細胞株における O- 結合型グリコシル化の阻害剤として使用されます。また、HT-29 細胞における 2,3 (O) - シアリルトランスフェラーゼおよび糖タンパク質輸送の阻害剤としても使用されています。本品は、N- アセチル -β- グルコサミニルトランスフェラーゼの基質です。						
DNA Methyltransferase Inhibitor II, SGI-1027		461.5	≥ 88% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	260921-10MG	30,900
N-(4-(2-Amino-6-methylpyrimidin-4-ylamino) phenyl)-4-(quinolin-4-ylamino)-benzamide, S-1027	マイコプラズマ・スピロプラズマ菌種ストレイン MQ1 の CpG DNA メチラーゼ M.SssI (それぞれ IC_{50} = 13.5 ならびに 16 µM、基質として Poly (dI-dC) と 75 あるいは 150 nM AdoMet) と同様に、酵素の共同因子結合部位を AdoMet (S-adenosyl-L-methionine 、SAM) と競合することでヒト DNMT1 (IC_{50} = それぞれ 6 ならびに 12.5 µM、基質としてヘミメチル化 DNA あるいは Poly (dI-dC)) やマウス DNMT3a & 3b (それぞれ IC_{50} = 8 ならびに 7.5 µM、基質として Poly (dI-dC)) を阻害する可能性のある細胞透過性のキノリン化合物。ゲノムレベルの低メチル化やカスパーゼ 3 活性を誘発することなく TSG (腫瘍抑制遺伝子) のプロモータ領域で見つかった CpG アイランドの異常メチル化を低減することで、ヒト結腸癌 RKO 培養において p16 mRNA (2.5 µM、7 日間) や MLH1 mRNA (2.5 µM、7 日間)、そして p16 タンパク質 (1.0 あるいは 2.5 µM、12 日間) 発現を再活性化するのにデシタビン (製品番号 189825) よりもそれぞれ 2 倍、3 倍、5 倍効果的であることが示されています。						
FPT Inhibitor I		467.4	> 95% by TLC	-70℃	H_2O (≥ 10 mg/ml)	344150-1MG	24,200
{(E,E)-2-[(Dihydroxyphosphinyl)methyl]-3-oxo-3-[(3,7,11-trimethyl-2,6,10-dodecatrienyl)-amino] propanoic Acid, 3Na}	強力かつ選択的なファルネシルトランスフェラーゼ (FTase) 阻害剤 (IC_{50} = 83 nM)。より高濃度においては、ゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ (GGTase) I および II も阻害します (GGTase I および II に対してそれぞれ IC_{50} = 26 µM および 47 µM)。						
FPT Inhibitor II		457.4	> 95% by TLC	-20℃	H_2O (≥ 10 mg/ml)	344152-1MG	20,000
{(E,E)-2-[2-Oxo-2-[[(3,7,11-trimethyl-2,6,10-dodecatrienyl)oxy]amino]ethyl]phosphonic Acid, 2Na}	ファルネシルトランスフェラーゼ (FTase) の強力かつ選択的な阻害剤 (IC_{50} = 75 nM)。また 25-250 µM においては、全細胞の Ras ファルネシル化も約 90%阻害します。						
FPT Inhibitor III		495.5	≥ 90% by HPLC	-20℃	H_2O (50 mg/ml)	344154-1MG	23,000
{(E,E)-[2-Oxo-2-[[(3,7,11-trimethyl-2,6,10-dodecatrienyl)oxy]amino]ethyl]phosphonic Acid, (2,2-Dimethyl-1-oxopropoxy)methyl Ester, Na}	Farnesyltransferase (FTase) inhibitor II (製品番号 344152) の細胞浸透性プロドラッグ。細胞の Ras プロセシングも阻害して、Ras を介したがん化を抑制します。						
FTase Inhibitor I		470.7	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	344510-1MG	28,000
{N-[2(S)-[2(R)-Amino-3-mercaptopropylamino]-3-methylbutyl]-Phe-Met-OH; B581}	ファルネシルトランスフェラーゼ (FTase) の強力かつ細胞浸透性阻害剤。FTase (IC_{50} = 21 nM *in vitro*) に対して、ゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ (GGTase; IC_{50} = 790 nM) に対するよりも 37 倍高い活性を示します。タンパク質分解に対して極めて高い抵抗性を示します。						
FTI-276		433.6	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml)	344550-250UG	33,900
{N-[2-phenyl-4-N[2(R)-amino-3-mercaptopropylamino benzoyl]-methionine, TFA}	強力かつ選択性の高い、Ras タンパク質のカルボキシル基末端配列をもつ CAAX ペプチド。*in vitro* でファルネシルトランスフェラーゼ (FTase) を阻害します (IC_{50} = 500 pM)。より高濃度においては、ゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ I (GGTase I) を阻害します (IC_{50} = 50 nM)。ヌードマウスにおいて、K-Ras がん遺伝子を発現しているヒト肺がん細胞の成長を選択的に阻害することが示されています。また 20 µM において、Ras がん遺伝子で形質転換した NIH/3T3 細胞のがん原性シクナリングおよび腫瘍成長も阻害します。						

アポトーシス・ネクローシス

FTase, GGTase, メチルトランスフェラーゼ 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
FTI-2628		542.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml) or Methanol (50 mg/ml)	344559-500UG	55,900
[2-(((5-((1H-Imidazol-4-ylmethyl)-amino)-methyl)-2′-methyl-biphenyl-2-carbonyl)-amino)-4-methylsulfanyl-butyric acid benzyl ester]	タンパク質ゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ I に対しタンパク質ファルネシルトランスフェラーゼ活性 (IC_{50} = 哺乳類用は 530 nM、*P.* マラリア用は 1.0 μM) を優先的に阻害する FTI-2148 (製品番号 344557) の細胞透過性のベンジルエステルプロドラッグ形態。H-ras 癌遺伝子形質転換 NIH/3T3 細胞 (IC_{50} = 20 nM) を強度に Ras ファルネシルを破壊し、赤血球 (ED_{50} = 150 nM) の *P. falciparum* の増殖を阻害します。また、*P. berghei* に感染したマウスの寄生虫血症を明確な毒性なしで 46.1%抑制します。						
GGTI-286		429.6	≥ 93% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	345878-250UG	33,900
{N-4-[2(R)-Amino-3-mercaptopropyl]amino-2-phenylbenzoyl-(L)-leucine methyl ester, TFA}	細胞浸透性を示す強力かつ選択的な GGTase I 阻害剤。GGTI-287 (製品番号 345880) のメチルエステル誘導体であり、FTI-277 (製品番号 344555) の 25 倍のゲラニルゲラニル化タンパク質 Rap1A のプロセシング阻害活性を示します (IC_{50} = 2 μM に対して 50 μM)。発がん性 K-Ras4B と選択的に拮抗します (IC_{50} = 2 μM)。GGTI-286 は、ヒト悪性神経膠腫細胞に対する顕著な抗増殖作用があることも示されています。						
GGTI-298		479.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) . Degas DMSO just prior to reconstitution.	345883-250UG	23,000
{N-4-[2(R)-Amino-3-mercaptopropyl]amino-2-naphthylbenzoyl-(L)-Leucine methyl ester, TFA}	GGTase I inhibitor GGTI-297 (製品番号 345882) の細胞浸透性プロドラッグです。Rap1A のプロセシングを阻害しますが (IC_{50} = 3 μM)、H-Ras のプロセシングに対しては、濃度を 15 μM に高めても作用しません。PDGF 受容体チロシンのリン酸化を阻害します。また、細胞周期を G_0/G_1 期で停止させ、アポトーシスを誘導し、IL-1β による iNOS の誘導を促進します。						
GGTI-2147		470.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml)	345885-250UG	37,900
{4-[[N-(Imidazol-4-yl) methyleneamino]-2-(1-naphthyl) benzoyl]leucine methyl ester}	ゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ I (GGTase I) の強力かつ選択的阻害剤として作用する、細胞浸透性非チオールペプチド様物質です。Rap1A のゲラニルゲラニル化阻害の IC_{50} 値は、H-Ras のファルネシル化の阻害に要する IC_{50} 値の 1/60 未満です (Rap1A:IC_{50} = 500 nM; H-Ras:IC_{50} ≤ 30 μM)。						
L-744,832		632.7	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml) or H_2O (15 mg/ml)	422720-5MG	33,000
{(2S)-2-[[(2S)-2-[(2S,3S)-2-[(2R)-2-Amino-3-mercaptopropyl]amino]-3-methylpentyl]oxy]-1-oxo-3-phenylpropyl]amino]-4-(methylsulfonyl)-butanoic Acid 1-Methylethyl Ester; L-744,382}	強力で選択的なチオール含擬ペプチドでファルネシルトランスフェラーゼ (FTase) 阻害剤。抗腫瘍作用を有します。p70s6k の活性化と DNA 合成を急速にブロックし、トランスジェニックマウスにおけるアポトーシスを促進します。 p21 発現を誘導し、細胞周期を G1 停止させます。パクリタキセルおよびエポチロンと協奏的に作用し腫瘍増殖を阻害します。また、ラパマイシン (製品番号 553210) と多く共通する効果をもちます。 mTOR/p70s6k 経路に異常活性化を示しているがんに対し抑制的に作用します。						
Protein Arginine N-Methyltransferase Inhibitor, AMI-1		592.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (50 mg/ml)	539209-5MG	27,900
(PRMT Inhibitor, AMI-1)	細胞透過性の対称スルホン化尿素化合物。タンパク質アルギニン N- メチルトランスフェラーゼ (PRMT) に対する強力かつ特異的な非 AdoMet (S- アデノシル -L- メチオニン、SAM) 競合阻害剤として作用します [IC_{50}=8.81 μM (PRMT1)、3.03 μM (酵母 RMT1p)]。リジンメチルトランスフェラーゼにはほとんど作用を示しません。MCF-7 細胞における核内受容体レポーター遺伝子の活性化を抑制し、HIV-1 RT ポリメラーゼを阻害します (IC_{50}=5 μM)。						
Protein Methyltransferase Inhibitor, AMI-5	17372-87-1	745.9	≥ 90%	+4℃	H_2O (50 mg/ml)	539211-50MG	21,900
Disodium-2-(2,4,5,7-tetrabromo-3-oxido-6-oxoxanthen-9-yl) benzoate	細胞透過性を有するキサンテニル化合物。アルギニンメチルトランスフェラーゼ (PRMT1 および Hmt1p に対する IC_{50}=1.41 μmol/L および 0.78 μmol/L) ならびにリジンメチルトランスフェラーゼ SET7 および DOT1 に対して AdoMet (SAM) 競合的かつ非特異的等力価阻害剤として作用します。						
Protein Synthesis Initiation Inhibitor, NSC 119889		647.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (200 mg/ml) or Methanol	539690-25MG	39,000
(3,4,5,6-Tetrabromofluorescein)	細胞透過性のキサンテニル化合物。mRNA- リボソーム相互作用を抑制し、5′ 末端 /cap 依存的タンパク質合成の開始を阻害します (クレブス、ウサギ網状赤血球、または *E. coli* S30 抽出物を用いた *in vitro* 翻訳アッセイにおいて 50 μM で >95% 阻害)。HCV IRES (Internal Ribosome Entry Site) によって開始される cap 非依存的翻訳に対する作用は極めて弱く、伸長および終了には阻害作用を示しません。また、Bax-Bcl-X_L 相互作用を阻害 (50 μM で 28.8% 阻害) することによって Bcl-X_L 過剰発現 MCF7 細胞におけるアポトーシスを誘導することが報告されています。						

Granzyme 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Granzyme B Inhibitor I		441.9	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	368050-1MG	19,900
(Z-AAD-CMK)	ヒトおよびマウスグランザイム B に対する微弱な阻害剤。グランザイム B と相同なラットリンパ球顆粒プロテアーゼフラグメンチン 2 による、リンパ球 DNA のアポトーシス性断片化も阻害します (ID_{50} = 300 nM)。						
Granzyme B Inhibitor II		502.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml)	368055-1MG	17,000
(Ac-IETD-CHO; Caspase-8 Inhibitor I)	グランザイム B およびカスパーゼ 8 の強力かつ可逆的な阻害剤。						
Granzyme B Inhibitor IV		498.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	368056-1MG	24,900
(Ac-IEPD-CHO; Caspase-8 inhibitor III)	グランザイム B およびカスパーゼ 8 の強力かつ可逆的な阻害剤。						

アポトーシス・ネクローシス

TNF-α 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Tumor Necrosis Factor-α Antagonist		1226.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	50% Acetic Acid (5 mg/ml)	654255-1MG	44,000
(TNF-α Antagonist; Tumor Necrosis Factor-α Antagonist; WP9QY)	TNF-α 結合アッセイにおけるアンタゴニスト (IC_{50} = 5 μM)。また、TNF-α 媒介性のアポトーシスを阻害します。なお、WP9QY という名前は、TNF-β/TNF 受容体 (I) 複合体中に見られる WP9 と名付けられた部位に結合することと、アミノ酸の Gln と Tyr が導入されていることに由来しています。						
TNF-α Inhibitor		629.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	654256-5MG	53,900
[6,7-Dimethyl-3-((methyl-(2-(methyl-(1-(3-trifluoromethyl-phenyl)-1H-indol-3-ylmethyl)-amino)-ethyl)-amino)-methyl)-chromen-4-one, diHCl; TNF-α Inhibitor; Tumor Necrosis Factor-α Inhibitor]	細胞透過性のインドリルクロメノン化合物。TNF-α 三量体に非共有結合的に結合してサブユニットの解離を促進し、TNF-α が受容体に結合するのを妨げることにより、TNF-α を迅速に不活化します (IC_{50}=22 μM)。HeLa 細胞において TNF-α が誘導する IkB-α の分解を選択的に阻害しますが、IL-1β 誘導性のものは阻害しないことが示されています (IC_{50}=4.6 μM)。						
TNF-α Antagonist III, R-7050	303997-35-5	380.8	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	654257-10MG	30,900
8-Chloro-4-(phenylsulfanyl)-1-(trifluoromethyl)[1,2,4]triazolo[4,3-a]quinoxaline	細胞透過性のトリアゾロキノキサリン化合物。TNF-α 誘導性の ICAM-1 (細胞内接着分子 -1) 発現を可逆的に抑制し、IL-1β 刺激に対するよりやや高い選択性を示します (TNFα および IL-1β で誘導した A549 細胞におけるそれぞれの EC_{50} = 0.631 μM、1.45 μM)。リガンド依存性 TNFαRI エンドサイトーシスの抑制によって TNFαRI/TRADD/RIP1 相互作用を破壊し、NF-κB、JNK、p38 MAPK およびアポトーシス経路の活性化を阻害することが知られています。						

アポトーシス阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Apoptosis Inhibitor	54135-60-3	236.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or Ethanol (20 mg/ml)	178488-10MG	26,900
[M50054; 2,2'-Methylenebis(1,3-cyclohexanedione)]	アポトーシス誘導阻害剤として働く細胞浸透性のビス (シクロヘキサン -1,3- ジケトン) (FasL 刺激 WC8 細胞における IC_{50}=67 μg/ml、エトポシド刺激 U937 細胞では 130 μg/ml)。						
Apoptosis Inhibitor II, NS3694	426834-38-0	358.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml). Slightly soluble in ethanol.	178494-10MG	28,900
(NS3694)	チトクローム c 放出によって誘発される活性アポトソーム複合体 (約 700 kDa) の形成を特異的に阻害する細胞透過性のジアリール尿素化合物。アポトソームが媒介するカスパーゼの活性化および細胞死から保護します (50 μM で MCF-casp3 細胞における TNF-α 誘導性細胞死を完全にブロック)。M50054 (製品番号 178488) とは異なり、NS3694 はアポトソーム非依存的カスパーゼ活性化および FasL によって誘導される細胞死には、ほとんど影響を示しません。チトクローム c 放出もカスパーゼの酵素活性も阻害しません。						
Autophagy Inhibitor, 3-MA	5142-23-4	149.2	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml). In applications where high working concentrations are necessary (e.g. 10 mM), the use of a pre-made stock solution may result in the introduction of higher than desired solvent (e.g., DMSO) into the experimental systems. In such cases, it	189490-50MG	14,900
3-Methyladenine	細胞透過性の抗アポトーシス化合物。オートファゴソーム形成、チトクローム c 放出およびカスパーゼ活性化を強力に抑制します。また、クラス III PI 3-K の ATP 競合的なやや弱い阻害剤として作用します (p150 トランスフェクション HT-29 細胞において 10 mM で 85-90% 阻害)。LY294002 (製品番号 440202) および Wortmannin (製品番号 681675) とは異なり、3-MA は TGN (トランスゴルジ網) への初期エンドソーム輸送を選択的に阻害し、膜トラフィッキング全体には影響を与えません。						
Bax Channel Blocker		695.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	196805-5MG	23,900
[(±)-1-(3,6-Dibromocarbazol-9-yl)-3-piperazin-1-yl-propan-2-ol, bis TFA]	細胞透過性のジブロモカルバゾール - ピペラジン誘導体で、抗アポトーシス活性を有します。Bax チャネル形成を阻害 (リポソームチャネルアッセイで IC_{50} = 0.52 μM) し、Bid- 誘導のチトクローム C の HeLa 細胞ミトコンドリアからの放出を効率的にブロックします (5 μM で約 80%の阻害)。						
Bax Channel Blocker II, iMAC2	335166-00-2	542.1	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml)	196806-10MG	29,900
(±)-3,6-Dibromo-9-(2-fluoro-3-piperazin-1-yl-propyl)-carbazole, 2HCl, MAC Inhibitor II	高い透過性のために、無細胞ミトコンドリア調製 (5 μM の各阻害剤により 40%, 77% の阻害) における Bid 誘発性シトクローム c の放出を防ぐことにおいて iMAC よりも有効性が低いが、無傷の FL5.12 細胞 (Complete vs ~35% inhibition with 5 μM respective inhibitor) の STS (製品番号 569396、569397) 誘発性シトクローム c 放出を阻害することにおいては iMAC (製品番号 196805) よりも効果的だと報告されている MAC (ミトコンドリアのアポトーシス誘発 Channel) 阻害剤 iMAC1 構造類似体。IMAC2 もまたアポトーシスの FL5.12 細胞 (それぞれ iMAC2 and iMAC1 の場合、IC_{50} = 28 vs 300 nM) から再構成ミトコンドリア外膜において MAC 介在電流の優れたブロッキング剤であり、STS 誘発アポトーシス (IC_{50} = 2.5 μM) から FL5.12 を守ることを示しています。						
Bax-Inhibiting Peptide, V5		586.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	196810-5MG	24,900
(BIP-V5; H-VPMLK-OH)	Ku70-Bax 阻害ドメインの 5 アミノ酸ペプチドで、細胞透過性の細胞保護作用をもつ物質。Bax を介するアポトーシスを阻害 (約 50 - 200 μM) し、Caspase Inhibitor VI (Z-VAD-FMK; 製品番号 219007) と同程度の作用を示します。また、カスパーゼ非依存的な細胞壊死も効率的に抑制します。Ku70 に競合的に Bax と相互作用し、その構造変化とミトコンドリアへの移行を阻止します。培地中で長時間 (約 3 日間) 安定。ネガティブコントロールとして製品番号 196811 を使用できます。						
Bax-Inhibiting Peptide, Negative Control		600.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	196811-5MG	24,900
(BIP-NC; H-IPMIK-OH)	Bax-Inhibiting Peptide, V5 (製品番号 196810) のアナログで、同じく細胞透過性のネガティブコントロール。200 μM でも Bax を介するアポトーシスを阻害しません。						
Bcl-xL BH44-23, Human, Cell-Permeable		3825.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or 20% Acetic Acid (5 mg/ml)	197217-1MG	50,900
(Ac-GRKKRRQRRR-βA-SNRELVVDFLSYKLSQKGYS-OH; HIV-TAT_{48-57}-β-Ala-Bcl-x_L $BH4_{4-23}$)	細胞膜透過性の高いペプチド。電位依存性アニオンチャネル (VDAC) に直接結合してその活性を阻害することによって、アポトーシス性細胞死を抑制します。チトクローム c 放出を阻害し、ミトコンドリア膜電位 (δ Ψ $_m$) を消失させます。リポソームおよび単離ミトコンドリアにおける VCAD 活性の阻害に不可欠であることが示されている Bcl-x_L の N 末端保存ホモロジードメイン (BH4; amino acids 4-23) を含んでいます。BH4 ドメインは、担体ペプチドである 10 アミノ酸残基の HIV-TAT_{48-57} 配列に β- アラニン残基をスペーサーとして結合しており、この β- アラニン残基によって最大限の柔軟性が得られます。細胞内に取り込まれた後に主としてミトコンドリア内に局在します。						
Fas/FasL Antagonist, Kp7-6		1077.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	H_2O (1 mg/ml)	341291-25MG	65,900
(H-YC*DEHFC*Y-OH, Cyclic [Cys-Cys disulfide]; Kp7-6)	Fas/FasL を介した細胞アポトーシスシグナルを特異的に拮抗する、環外システインノットペプチドです (1 mg/ml で Jurkat 細胞における FasL 誘導アポトーシスを 58% 抑制)。FasL (製品番号 PF033 および PF092) (K_d= 11.2 μM) および Fas (CD95/APO-1) (K_d= 13.2 μM) に高い親和性で結合し、受容体の調和を崩し、シグナル伝達経路を変化させます。*in vivo* マウス肝炎モデルにおいて Con A (製品番号 234567) 誘発肝障害を抑制することが明らかになっています。TNF-α および TNFR には結合しません。						

アポトーシス・ネクローシス

アポトーシス阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Mitochondrial CTP Inhibitor	412940-35-3		≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	475877-5MG	18,000
4-chloro-3-{[(3-nitrophenyl)amino]sulfonyl}benzoic acid	ミトコンドリアのクエン酸輸送タンパク質（CTP）の純粋にクエン酸競合的な阻害剤。濃度 1 mM においてクエン酸輸送を 85% 阻害します。						
Omi/HtrA2 Protease Inhibitor, Ucf-101		495.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	496150-10MG	26,900
{High Temperature Requirement A2 Inhibitor I; 5-[5-(2-Nitrophenyl)furfurylidine]-1,3-diphenyl-2-thiobarbituric Acid}	細胞透過性の furfurylidine-thiobarbituric acid 化合物で、強力で選択的な、競合的、可逆的な、アポトーシス性熱誘導ミトコンドリアセリンプロテアーゼ Omi/HtrA2 の阻害剤（His-Omi$_{134-458}$ に対して IC_{50} = 9.5 μM ）。他のセリンプロテアーゼにはほとんど影響しません（IC_{50} > 200 μM）。カスパーゼ - $^{(-/-)}$ null fibroblast で Omi/HtrA2 誘導したアポトーシスを阻止することが報告されています。						
Pifithrin-α	63208-82-2	367.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	506132-5MG 506132-10MG	19,900 31,900
[2-(2-Imino-4,5,6,7-tetrahydrobenzothiazol-3-yl)-1-*p*-tolylethanone, HBr]	p53 の化学的阻害物質。p53 応答遺伝子の p-53 依存的転写促進を可逆的に阻害します。また p-53 を介したアポトーシスを可逆的に阻害します。ヒト二倍体繊維芽細胞の、DNA 損傷に反応して起こる p-53 依存的発育停止を阻害します。しかし、p-53 欠損繊維芽細胞には作用しません。化学療法の有害な副作用より正常組織を保護します。						
Pifithrin-α, Cyclic-	60477-34-1	349.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	506134-10MG	35,900
[2-(4-Methylphenyl)imidazo[2,1-b]-5,6,7,8-tetrahydrobenzothiazole, HBr; QB102]	Pifithrin-α（製品番号 506132）の、ほぼ同じ生物学的機能を有し、極めて安定性が高く、細胞毒性が低い類似体です。p53 の化学的阻害物質です。p-53 応答遺伝子の p53 依存的転写促進を可逆的に阻害します。また、p-53 を介したアポトーシスを可逆的に阻害します。本品は強力な STAT6 転写阻害性を示すことが報告されています。						

アポトーシス誘導剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Oncrasin-1 (Oncogenic Ras Tumor-Inhibiting Compound 1)	75629-57-1	269.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO or Ethanol	496265-25MG	15,000
1-((4-Chlorobenzyl)-1H-indole-3-carboxaldehyde	細胞透過性のインドールカルボキシアルデヒド化合物。変異型 K-Ras 遺伝子をもつ細胞のアポトーシスを *in vitro*（H2887, H460, H2122, A549, および T29Kt1 培養細胞中ではそれぞれ IC_{50} = 0.11, 0.25, 1.0, 1.58, および 4.81 μM）および *in vivo*（マウスにおける H460 による腫瘍増殖を 75% 抑制；100 mg/kg を 1 日 1 回腹腔内投与時）において選択的に誘導しますが、野生型 Ras または変異型 N-Ras 遺伝子をもつ細胞に対する活性はほとんどないか、はるかに弱いものです（IC_{50} ≥ 31 μM）。Oncrasin-1 処理により、変異型 K-Ras 遺伝子を持つ培養細胞においては PKCι と核内スプライシング因子との会合ならびに PKCι と CDK9/Cyclin T1 複合体との解離が誘導され、その結果 RNA ポリメラーゼ II のリン酸化が減少し RNA プロセシング全般が抑制されることが判明しています。Oncrasin-1 誘導性細胞死には変異型 K-Ras 遺伝子と PKCi の両方の存在が必要です。いずれかの酵素を siRNA によりノックダウンすると、H460 および T29Kt1 培養細胞における Oncrasin-1 の細胞毒性が消失することが示されています。						

ネクローシス阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Necrosis Inhibitor, IM-54		325.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or Methanol (10 mg/ml)	480060-5MG	40,900
[2-(1H-Indol-3-yl)-3-pentylamino-maleimide]	細胞透過性のモノインドリルマレイミド化合物。酸化的ストレスが誘導する壊死性細胞死を選択的に防ぎます（100 μM の H_2O_2 に暴露した HL60 細胞において、約 3 μM の IM-54 により約 50% の細胞死が防がれます）。Etoposide（製品番号 341205）が誘導するアポトーシス対する保護作用は無く、酸化防止効果は示しません。S6K1 および PKC アイソザイムのキナーゼ活性には 50 μM の高濃度でも影響を与えません。						
Necrostatin-1	4311-88-0	259.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	480065-5MG	24,900
[5-(Indol-3-ylmethyl)-(2-thio-3-methyl)hydantoin; Nec-1; Necroptotic Inhibitor, Nec-1]	細胞透過性の強力かつ選択的なネクロトーシス阻害剤（TNF-α で処理した FADD 欠損 Jurkat 細胞における EC_{50}=494 nM）。マウス虚血性脳傷害モデルにおいて神経保護作用をもたらします。ネクロトーシスは、デスドメイン受容体（DR）によって媒介される非アポトーシス性の細胞壊死経路です。DR が誘導するアポトーシスには影響を示しません。Nec-1 の標的は実行段階の上流、DR の下流にあるネクロトーシスに共通する重要な段階であると思われます。対照用の不活性型 Nec-1i（製品番号 480066）も用意されています。						
Necrostatin-1, Inactive Control	64419-92-7	245.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	480066-5MG	24,900
[5-(Indol-3-ylmethyl)-2-thiohydantoin; Nec-1i]	細胞透過性を有する Nec-1（製品番号 480065）の N- 脱メチル化チオヒダントインアナログです。本品は anti-necroptotic 作用をもたず、ネガティブコントロールとして有用です。						

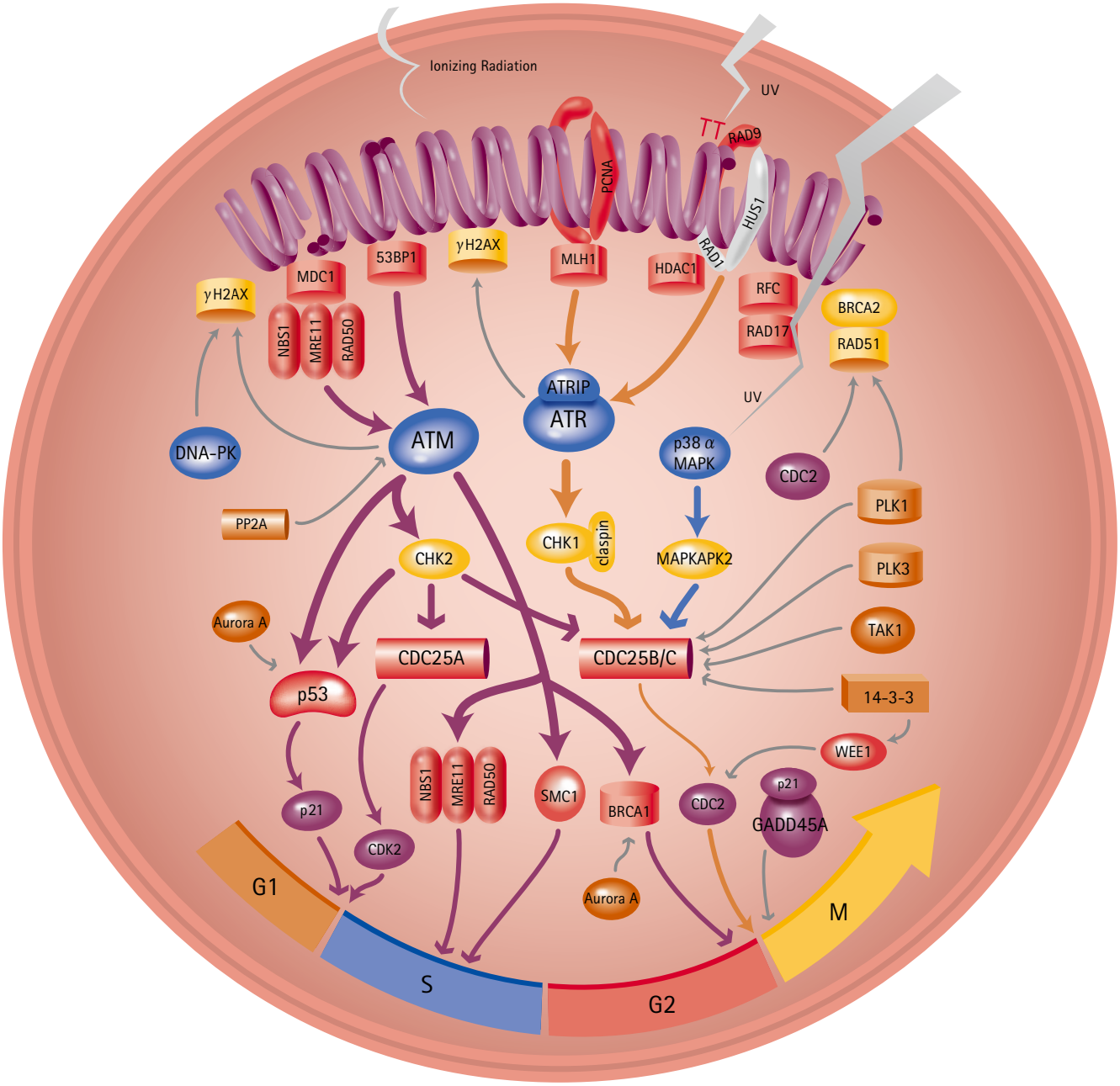
その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Interferon-α-IFNα-R Interaction Inhibitor		315.9	≥ 98% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	407325-25MG	38,900
Survivin Antagonist, S12		390.18	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO	574661-10MG	40,000

Checkpoint Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
ATR/CDK Inhibitor, NU6027	220036-08-8	251.28	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO	189299-10MG	28,900
Chk2 Inhibitor	724708-21-8	295.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	220485-500UG	51,900
5-(2-Amino-5-oxo-1,5-dihydroimidazol-4-ylidine)-3,4,5,10-2H-azepino[3,4-b]indol-1-one	Chk2 Inhibitor 細胞透過性のインドロアゼピン化合物。増殖抑制作用および抗炎症作用を示します。強力な Chk2 阻害剤として作用し（IC_{50}=8 nM）、Chk2 に対し優れた選択性を示します。MEK1（IC_{50}=89 nM）、Chk1（IC_{50}=237 nM）、CK1δ（IC_{50}=1,352 μM）、PKCα（IC_{50}=2.539 μM）、PKCβII（IC_{50}=3.381 μM）および CK2（IC_{50} > 10.0 μM）。NF-κB の転写活性化を抑制することによってサイトカインの産生を抑制します [IC_{50}=3.55 μM（PMA 誘導 Jurkat T 細胞における IL-2）、8.16 μM（LPS 刺激 THP-1 細胞における TNF-α）]。また、白血病 T 細胞の増殖を抑制します（GI_{50}=1.73 μM）。Sharma, V., and Tepe, J.J. 2004. Bioorg. Med. Chem. Lett. 14, 4319. Sharma, V., *et al.* 2004. J. Med. Chem. 47, 3700. 220485						
Chk2 Inhibitor II	516480-79-8	363.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	220486-1MG	24,900
[2-(4-(4-Chlorophenoxy)phenyl)-1H-benzimidazole-5-carboxamide]	細胞膜透過性のベンズイミダゾロ化合物。Chk2 の強力な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50}=15 nM、K_i=37 nM）。Chk2 に対して Cdk1/B（IC_{50}=12 μM）および CK1（IC_{50}=17 μM）より約 1,000 倍高い選択性を示し、Chk1 を含む 31 種類のキナーゼパネルの活性に対して弱い作用を示します（10 μM で < 25% 阻害）。末梢の CD4 陽性 T 細胞および CD8 陽性 T 細胞を γ 線照射によるアポトーシスから保護することが明らかになっています（CD4 +細胞に対して EC_{50}=3 μM,CD8 +細胞に対して EC_{50}=7.6 μM）。						
Chk2 Inhibitor, PV1019		379.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	220488-10MG	15,900
	強力な ATP 競合的高選択的 Chk2 阻害剤として作用する細胞透過性ニトロインドロ - グアニジノヒドラゾン化合物。10 μM または 1 mM ATP の存在下で、Chk2 によるヒストン H1 のリン酸化に対する IC_{50} は 138 nM および 570 nM です。これに比べて、Chk1 など、他 52 種の細胞キナーゼに対する活性ははるかに低い、もしくはまったくありません（10 μM ATP での基質リン酸化および Chk1 自己リン酸化に対する IC_{50} = 15.73 μM および 55 μM ）。培養 MCF7 における Chk2（Ser^{526}）の放射線誘発リン酸化とその下流基質 Cdc25c（Ser216）を有効に抑制し（IC_{50} <10 μM）、放射線誘発アポトーシスに対する野生型ネズミ胸腺細胞の感受性を $Chk2^{-/-}$ 培養物にみられるレベルに低下させることが示されています。						
MDM2 Antagonist IV, Nutlin-3a	675576-98-4			-20℃		444152-5MG	18,900
MPS1 Inhibitor, NMS-P715		676.31	≥ 98% by HPLC	+2℃～+8℃		475949-5MG	38,900
Polo-like Kinase Inhibitor IV, SBE13	916985-21-2	442.9	≥ 94% by HPLC	+4℃	DMSO	528281-10MG	17,900
Polo-like Kinase Inhibitor I	916985-21-2	487.6	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO	528282-5MG	37,900
Polo-like Kinase Inhibitor II, BTO-1	40647-02-7	264.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	528283-2MG	20,400
RAD51 Inhibitor, B02	1290541-46-6		≥ 98% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	553525-25MG	28,900
SB 218078	135897-06-2	393.4	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (20 mg/ml)	559402-1MG	26,900
[9,10,11,12,-Tetrahydro-9,12-epoxy-1*H*-diindolo(1,2,3-fg:3′,2′,1′-kl)pyrrolo(3,4-i)(1,6)benzodiazocine-1,3(2*H*)-dione]	*in vitro* でチェックポイントキナーゼ（Chk1）の強力かつ選択的な阻害剤として作用するインドロカルバゾール誘導体。cdc25C の Chk1 リン酸化を IC_{50} 15 nM で阻害します。しかし、SB-218078 は、Cdc2（IC_{50} = 250 nM）および PKC（IC_{50} = 1 μM）に対してははるかに弱い阻害作用を示します。						
Wee1/Chk1 Inhibitor		346.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml) or Ethanol (25 mg/ml)	681637-1MG	32,900
[4-(2-Phenyl)-9-hydroxypyrrolo[3,4-c]carbazole-1,3-(2H,6H)-dione]	ピロロカルバゾール化合物。チェックポイント・キナーゼ Wee1 および Chk1 の強力な ATP 競合阻害剤として作用します（それぞれ IC_{50}=97 nM および 47 nM）。PKC、Cdk4 または他の CDK は非常に高濃度でのみ阻害し（それぞれ、IC_{50}=3.4 μM、3.75 μM および 5 μM 以上）、FGFR、PDGFR または c-Src に対してはほとんど効果を示しません（IC_{50} > 50 μM）。						
Wee1 Inhibitor		362.8	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (10 mg/ml)	681640-1MG	29,000
[4-(2-Chlorophenyl)-9-hydroxypyrrolo[3,4-c]carbazole-1,3-(2H,6H)-dione]	ピロロカルバゾール化合物。 Wee1 の強力な ATP 結合部位ターゲティング阻害剤として ATP 競合的に作用し（IC_{50} = 11 nM）、関連チェックポイントキナーゼ Chk1（IC_{50} = 440 nM）より約 40 倍高い選択性を示します。						
Wee1 Inhibitor II		418.9	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (10 mg/ml)	681641-1MG	37,900
[6-Butyl-4-(2-chlorophenyl)-9-hydroxypyrrolo[3,4-c]carbazole-1,3-(2H,6H)-dione]	ピロロカルバゾール化合物。ATP 競合的に Wee1 を強力に阻害し（IC_{50}=59 nM）、Chk1（IC_{50}=35 μM）に対するよりも約 590 倍高い選択性を示します。						

Checkpoint Signaling and DNA Repair



阻害剤関連製品の最新情報はこちらから >> www.merckmillipore.jp/sogaizai

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

Cyclin-Dependent Kinase（Cdk）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Aminopurvalanol A [(2R)-2-((6-((3-Amino-5-chlorophenyl)amino)-9-(1-methylethyl)-9H-purin-2-yl)amino)-3-methyl-1-butanol; NG-97]	220792-57-4	403.9	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（40 mg/ml）	164640-5MG	42,000
抗有糸分裂性ならびに抗腫瘍性を示す細胞透過性の 2,6,9- 三置換プリンアナログ（NCI 60 細胞パネル *in vitro* 活性スクリーニングにおいて GI_{50} = 約 1.8 μM; KM12 大腸癌細胞の成長を GI_{50}=30nM で強力に阻害）。可逆的な ATP 競合性 Cdk 阻害剤（Cdk1/ サイクリン B および Cdk2/ サイクリン A に対しては IC_{50} = 33 nM、Cdk2/ サイクリン E に対しては 28 nM、Cdk5/p35 に対しては 20 nM）。試験した一群のキナーゼに対して、約 100 倍高い選択性を示します（IC_{50} ≥ 2.4 μM）。G2/M 期を優先的に標的化することによって細胞分化を誘導し、Cdk および MAPK を阻害することによって細胞内で作用することが示されています。さらに、対数増殖期にある *c-myc*$^{+/+}$ 細胞において、Etoposide（製品番号 341205）によるアポトーシスの誘導を妨げますが、Cisplatin（製品番号 232120）によるものはブロックしません。							
Arcyriaflavin A, Synthetic		325.3	≥ 95% by HPLC	−20℃	DMSO（50 mg/ml）	181305-1MG	34,900
この化合物は元来、*Eudistoma* 属のホヤから分離されました。細胞培養において、ヒトサイトメガロウイルス（HCMV）複製の強力な阻害剤として作用します（IC_{50} = 200 nM）。							
Bohemine [[6-Benzylamino-2-(3-hydroxypropylamino)-9-isopropylpurine]	189232-42-6	340.4	≥ 95% by HPLC	−20℃	DMSO（100 mg/ml）or Methanol（50 mg/ml）	203600-1MG 203600-5MG	16,000 39,000
細胞透過性の合成サイクリン依存性キナーゼ（CDK）阻害剤（IC_{50} = 1 μM）。Olomoucine（製品番号 495620）および Roscovitine（製品番号 557360）と構造が類似しています。細胞周期を G1/S 移行期で停止させ、*in vitro* ウシ成熟卵母細胞を単独でまたは Ionomycin（製品番号 407950 および 407952）との併用によって活性化します。							
CR8,（R）-Isomer 2-(R)-(1-Ethyl-2-hydroxyethylamino)-6-(4-(2-pyridyl)benzyl)-9-isopropylpurine	294646-77-8	431.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）or Ethanol（15 mg/ml）	203881-5MG	47,900
非常に強力（約 25 ～ 50 倍）な Roscovitine（製品番号 557360）のアナログ。細胞透過性。アポトーシスを速やかに誘導し（SH-SY5Y 細胞で IC_{50} = 290 nM、HEK293 細胞で IC_{50} = 560 nM）、抗増殖特性を示します（数種の腫瘍細胞の平均 IC_{50} = 390 nM）。Cdk（IC_{50} = 0.09 μM（Cdk1/B）、0.072 μM（Cdk2/A）、0.041 μM（Cdk2/E）、0.11 μM（Cdk5/p25）、1.1 μM（Cdk7/H）、0.18 μM（Cdk9/T））ならびに CK1δ/ε（IC_{50} = 0.4 μM）の強力かつ可逆性の ATP- 競合阻害剤として作用し、DyrK1A、Erk2、GSK-3α/β に対して比較的低い選択性を示します（それぞれ IC_{50} = 3.6、3.6、12 μM）。さらに、SH-SY5Y 細胞で Thr^{320}-PP1a、Ser^{249}/Thr^{252}-Rb および Ser2-RNA Pol II の Cdk 基質のホスホリル化を阻害します。							
CR8,（S）-Isomer 2-(S)-(1-Ethyl-2-hydroxyethylamino)-6-(4-(2-pyridyl)benzyl)-9-isopropylpurine,		431.5	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（35 mg/ml）or Ethanol（20 mg/ml）	203882-5MG	47,200
非常に強力（約 25 ～ 50 倍）な Roscovitine（製品番号 557362）のアナログ。細胞透過性。アポトーシスを速やかに誘導し（SH-SY5Y 細胞で IC_{50} = 230 nM）、抗増殖特性を示します（数種の腫瘍細胞の平均 IC_{50} = 390 nM）。Cdk（IC_{50} = 0.15 μM（Cdk1/B）、0.08 μM（Cdk2/A）、0.06 μM（Cdk2/E）、0.12 μM（Cdk5/p25）、0.11 μM（Cdk9/T））ならびに CK1δ/ε、DyrK1A 、Erk2（それぞれ IC_{50} = 0.61、0.9、2.1 μM）の強力かつ可逆性の ATP- 競合阻害剤として作用し、GSK-3α/β に対しては低い選択性を示します（IC_{50} > 30 μM）。さらに、SH-SY5Y 細胞で Thr^{320}-PP1a および Ser2-RNA Pol II の Cdk 基質のホスホリル化を阻害します。							
Butyrolactone I	87414-49-1	424.5	≥ 99% by TLC	−20℃		203988-200UG	39,900
細胞膜透過性の、高度に選択的なサイクリン依存性プロテインキナーゼ（Cdk）阻害剤。本品は、細胞周期進行を G_1/S、G_2/M 移行期で停止させます。$p34^{cdk1}$/ サイクリン B（Cdk1）を阻害します（IC_{50} = 680 nM）。また、Cdk2 キナーゼおよび Cdk5 キナーゼを選択的に阻害します。カゼインキナーゼ I、カゼインキナーゼ II、EGF 受容体キナーゼ、MAP キナーゼ、PKA、PKC にはほとんど作用を及ぼしません。網膜芽細胞腫タンパク質および H1 ヒストンのリン酸化を阻害することが示されています。また、HL-60 細胞における Fas 誘導性アポトーシスを抑制し、ヒト肺がん細胞株に対する抗腫瘍作用を示します。							
Cdk1 Inhibitor [3-(2-Chloro-3-indolylmethylene)-1,3-dihydroindol-2-one]	220749-41-7	294.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（200 mg/ml）	217695-5MG	27,900
強力な増殖抑制作用を示すインドリル - メチレン -2- インドリノン誘導体 [IC_{50} = 2 μM（HeLa 細胞）]。サイクリン依存性キナーゼ 1/ サイクリン B に対する選択的な ATP 競合阻害剤として作用します [IC_{50} = 5.8 μM（Cdk1）、25 μM（Cdk5）]。Cdk1 活性部位の ATP ポケットに結合します。100 μM の濃度でも GSK-3β の活性に影響を与えません。							
Cdk1 Inhibitor, CGP74514A [N-(*cis*-2-Aminocyclohexyl)-N-(3-chlorophenyl)-9-ethyl-9H-purine-2,6-diamine; CGP74514A]	190654-01-4	385.9	≥ 95% by HPLC	−20℃	DMSO（10 mg/ml）	217696-5MG	35,900
Cdk1/ サイクリン B の強力な選択的阻害剤として働く細胞透過性の 2,6,9- 置換プリン誘導体（IC_{50} = 25 nM）。他のキナーゼの活性には非常に高濃度でのみ影響すると報告されています（PKC-α、PKA および EGFR に対して、それぞれ IC_{50} = 6.1 μM、125 μM および > 10 μM）。いくつかのヒト白血病細胞株でミトコンドリア損傷およびアポトーシス（>3 μM）を誘導することが示されています。より低い濃度（約 1 μM）では、はじめに G2M 停止が U937 細胞で観察されていますが、これは最終的にはアポトーシスへと導かれます。							
Cdk1 Inhibitor III [Ethyl-(6-hydroxy-4-phenylbenzo[4,5]furo[2,3-b])pyridine-3-carboxylate]		333.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（20 mg/ml）or Ethanol（10 mg/ml）	217697-1MG	24,000
1-aza-9-oxafluorene 化合物で Cdk1/cyclin B の高い選択性を持つ阻害剤（IC_{50} = 28.8 μM）。Cdk5/p25, Cdk2/E, or Cdk4/D1 にはほとんど影響しません。他の Cdk 阻害剤と異なり、がん細胞において P-glycoprotein-mediated MDR（multidrug resistance）を強力に阻害します（ベラパミルの 9 倍強力）。これらの Bifunctional な静細胞性はがん治療研究の優れたツールとなります。							
Cdk1 Inhibitor IV, RO-3306		351.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	217699-5MG	48,900
細胞透過性のキノリニルチアゾリノン化合物。Cdk1 の強力かつ可逆的な ATP 競合阻害剤として作用し（Cdk1/B1 および Cdk1/A に対して、それぞれ K_i=35 nM および 110 nM）、Cdk2/E、Cdk4/D、PKCδ および SGK には選択性を示します（それぞれ、K_i=340 nM、> 2.0 μM、318 nM および 497 nM）。また、Akt、EphB3、Fyn、PKA および PKCα の活性に弱く影響します（K_i > 2.0 μM）。9 μM でいくつかのヒトがん細胞を G2/ M期で可逆的に停止させ、有糸分裂状態を 20 時間有効に維持することが示されており、約 72 時間の長期の暴露ではアポトーシスを引き起こします。							
Cdc7/Cdk9 Inhibitor 2-(Pyridin-4-yl)-1,5,6,7-tetrahydro-4H-pyrrolo[3,2-c]pyridinone	845714-00-3	213.2	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）	217707-5MG	44,000
細胞透過性のピロロピリジノン化合物。Cdc7 および Cdk9 の強力かつ可逆的な ATP 競合的阻害剤として作用し（IC_{50} = 10 および 34 nM）、GSK-3β、Cdk2、Cdk1、Cdk5、MK-2、Plk1 および Chk2（IC_{50} = 0.22、0.24、0.25、0.46、0.47、0.98 および 1.1 μM）を含む 31 種類の他のキナーゼに対するより優れた選択性を示します。PHA76749 の細胞処理によって DNA 複製起点の活性化が抑制されますが、複製フォークの延長は阻害されません。*in vitro* で 61 種類の細胞株の増殖を阻害し（IC_{50} <10 μM）、*in vivo* でマウスおよびラットにおいて抗腫瘍活性を示すことが知られています。							
Cdk1/2 Inhibitor II, NU6102 [6-Cyclohexylmethoxy-2-(4′-sulfamoylanilino)purine]		402.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（20 mg/ml）	217713-1MG 217713-5MG	16,000 42,000
抗増殖性を示す 2,6- 二置換プリン化合物。Cdk1/ サイクリン B および Cdk2/ サイクリン A3 の強力な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 9.5 nM および 5.4 nM）。試験した他のキナーゼよりも高い選択性を Cdk に対して示します（Cdk2/A、ROCKII、PDK1、DYRK1A および Cdk4/D1 に対して、それぞれ IC_{50} = 30 nM、600 nM、800 nM、900 nM および 1.6 μM）。ヒト MCF-7 乳がん細胞の増殖を GI_{50}=8 μM で阻害することが示されています。							

細胞周期・細胞分裂

Cyclin-Dependent Kinase（Cdk）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Cdk2 Inhibitor II （Compound 3）		395.2	≥ 95% by HPLC	−20℃	DMSO（5 mg/ml）	219445-1MG 219445-5MG	10,900 35,900
	Cdk2 に対する強力かつ選択的な阻害剤です（IC_{50} = 60 nM）。						
Cdk2/5 Inhibitor [N^4-(6-Aminopyrimidin-4-yl)-sulfanilamide, HCl; PNU 112455A]		301.8	≥ 95% by HPLC	−20℃	DMSO（100 mg/ml）	219448-5MG	25,000
	Cdk2 および Cdk5 の選択的な ATP 競合阻害剤として働くアミノピリミジン誘導体（Cdk2/GST- サイクリン E および Cdk5/GST-p25 に対する K_i=2 μM）。						
Cdk Inhibitor, p35 [2-(3-Hydroxypropylamino)-6-(*o*-hydroxybenzylamino)-9-isopropylpurine]		356.4	≥ 95% by HPLC	−20℃	DMSO（10 mg/ml）	219457-1MG	19,900
	Olomoucine（製品番号 495620）の類似体。Cdk1（IC_{50}=100nM）と Cdk2（IC_{50}=80nM）の強力な阻害剤として作用します。また、抗増殖作用およびアポトーシス促進作用を示します。						
Cdk4 Inhibitor [2-Bromo-12,13-dihydro-5H-indolo[2,3-a]pyrrolo[3,4-c]carbazole-5,7(6H)-dione]	546102-60-7	404.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（1 mg/ml）	219476-1MG	18,000
	抗増殖性を示す細胞透過性の非対称インドロカルバゾール化合物。Cdk4/D1 の強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 0.076 μM）。非常に高い濃度では他の Cdk の活性も阻害しますが（Cdk2/E および Cdk1/B に対して、それぞれ IC_{50} = 0.52 および 2.1 μM）、CaMKII、PKA または GSK-3β に対してはほとんど活性を示しません（IC_{50} ≥ 12.4 μM）。Rb のリン酸化を妨げ、細胞周期の G1 停止を誘導することによって、腫瘍細胞の増殖を阻害することが示されています（HCT-116 および NCI-H460 細胞に対する IC_{50} < 3.0 μM）。						
Cdk4 Inhibitor II, NSC 625987 [1,4-Dimethoxyacridine-9(10H)-thione]	141992-47-4	271.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）or Ethanol（2.5 mg/ml）	219477-5MG	33,900
	Thioacridone 化合物。Cdk4/D1 の強力な基質競合阻害剤（IC_{50} = 200 nM）として作用し、Cdc2/A、Cdk2/A および Cdk2/E（IC_{50} > 100 μM）より約 500 倍高い選択性を示します。						
Cdk4 Inhibitor III [5-(N-(4-Methylphenyl)amino)-2-methyl-4,7-dioxobenzothiazole]	265312-55-8	284.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	219478-5MG	36,000
	細胞透過性のジオキソベンゾチアゾール化合物。選択的な Cdk4 阻害剤として作用します（Cdk4/D1 に対する IC_{50}=6.0 μM、Cdk2/A に対しては 200 μM 以上）。癌細胞に対して Cisplatin（製品番号 232120）よりも優れた細胞障害能を示します（A 549、Col 1、HL-60 および HepG2 腫瘍細胞に対して、それぞれ IC_{50}=0.61、1.08、0.30 および 1.21 μg/ml）。						
Cdc2-Like Kinase Inhibitor, TG003 [Clk Inhibitor, TG003; (Z)-1-(3-Ethyl-5-methoxy-2,3-dihydrobenzothiazol-2-ylidene)propan-2-one]	300801-52-9	249.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）or Methanol（50 mg/ml）	219479-5MG	23,000
	強力かつ特異的、可逆的な Clk キナーゼファミリーの ATP 競合阻害剤として働く、細胞透過性のジヒドロベンゾチアゾロ化合物（mClk1/Sty に対する K_i = 10 nM; mClk4、mClk1、mClk2 および mClk3 に対してはそれぞれ、IC_{50} = 15 nM、20 nM、200 nM および > 10μM）。1 μM までは SRPK1、SRPK2、PKA または PKC の活性に影響を与えません。Ser/Arg リッチ（SR）タンパク質のリン酸化によって媒介される選択的スプライシングの調節を変化させることが *in vitro* および *in vivo* の両方で示されています。過剰なレベルの Clk 活性によって誘導されるアフリカツメガエルの初期発生異常を抑制します。						
Cdk/Crk Inhibitor [1-(2,6-Dichlorophenyl)-1,5-dihydro-6-((4-(2-hydroxyethoxy)phenyl)methyl)-3-(1-methylethyl)-4H-pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-4-one; RGB-286147]	784211-09-2	473.4	≥ 95% by HPLC	−20℃	DMSO（5 mg/ml）	219491-1MG	36,000
	細胞透過性のピラゾロピリミジノン化合物。Cdk に対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します（Cdk1/B、Cdk2/E、Cdk3/E、Cdk5/p35、Cdk7/H/MAT1 および Cdk9 に対して、それぞれ IC_{50}=48 nM、15 nM、9 nM、10 nM、71 nM および 9 nM）。Cdk4/D1、Cdk6/D3 および GSK-3β は非常に高濃度でのみ阻害し（それぞれ IC_{50}=839 nM、282 nM および 754 nM）、他の 60 種類のキナーゼパネルに対してはほとんど活性を示しません。腫瘍細胞の増殖を広範に阻害しますが、形質転換していない非活動性繊維芽細胞の増殖は阻害しません。						
Cdk4/6 Inhibitor IV trans-4-((6-(ethylamino)-2-((1-(phenylmethyl)-1H-indol-5-yl)amino)-4-pyrimidinyl)amino)-cyclohexanol	359886-84-3	456.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	219492-5MG	32,000
	細胞透過性のトリアミノピリミジン化合物。Cdk4/6 の可逆的・ATP 競合的阻害剤として作用し（Cdk4/D1 および Cdk6/D1 に対する IC_{50} はそれぞれ 1.5 μM および 5.6 μM）、Cdk5/p35（IC_{50} = 25 μM）、v-abl、c-met、IGF-1R および IR（IC_{50} > 10 μM）、Cdk2/A、Cdk2/E、Cdk4/D2、Cdk6/D2（IC_{50} > 50 μM）および Cdk1/B（IC_{50} > 100 μM）よりも高い選択性を示します。濃度 5-10 μM において、U2OS および MRC-5 細胞における pRb の Ser^{780} および Ser^{795} におけるリン酸化を阻害し、細胞周期停止（G_0/G_1）とアポトーシスを誘導することが判明しています。さらに、異種移植マウスモデルにおいて腫瘍増殖を抑制します（30 mg/kg、腹腔内投与）。						
Cdk/CKI Inhibitor,（R）-DRF053 2-(R)-(1-Ethyl-2-hydroxyethylamino)-6-(3-(2-pyridyl)phenylamino)-9-isopropylpurine		435.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）or Ethanol（30 mg/ml）	219494-5MG	44,000
	細胞透過性を有するプリン三置換体化合物。Cdk および CKI に対する強力な ATP 競合型可逆的阻害薬として作用します（Cdk1/B、Cdk5/p25、CK1δ/ε、GSK-3α/β に対する IC_{50}=0.22 μmol/L、0.08 μmol/L、0.014 μmol/L、4.1 μmol/L）。N2A-APP_{695} 細胞において $A\beta_{40}$ 産生を阻害します（IC_{50} < 33 μmol/L）。						
Compound 52 [2-(2-Hydroxyethylamino)-6-(3-chloroanilino)-9-isopropylpurine]	212779-48-1	346.8	≥ 97% by HPLC	−20℃	DMSO（200 mg/ml）	234503-1MG	19,000
	細胞周期制御キナーゼ Cdc28p（IC_{50} = 7 μM）および関連する Pho85p キナーゼ（IC_{50} = 2 μM）に対する、強力かつ細胞膜透過性を有する選択的阻害剤です。						
Cdk2 Inhibitor III [2(*bis*-(Hydroxyethyl)amino)-6-(4-methoxybenzylamino)-9-isopropyl-purine]	199986-75-9	400.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	238803-1MG 238803-5MG	17,000 56,900
	Cdk2 の強力かつ選択的、可逆的な ATP 競合阻害剤として働く細胞透過性のプリンアナログ（Cdk2/A および Cdk2/E に対する IC_{50} = 0.5 μM; Cdk1/B に対しては 4.2 μM; Cdk4/D1 に対しては 215 μM）。他のキナーゼは非常に高い濃度でのみ阻害します（MAPK、PKA および PKC に対する IC_{50} > 1.25 mM）。*in vitro* で腫瘍細胞の増殖停止を誘導し（IC_{50} = 約 1.25-20 μM）、*in vivo* で新内膜形成を妨げることが示されています。						
Cdk2 Inhibitor IV, NU6140 [4-(6-Cyclohexylmethoxy-9H-purin-2-ylamino)-N,N-diethylbenzamide]	444723-13-1	422.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	238804-5MG	40,900
	細胞透過性の高いプリン化合物。Cdk に対する選択的な ATP 競合阻害剤として作用し［IC_{50}=6.6 μM（Cdk1/B）、0.41 μM（Cdk2/A）、5.5 μM（Cdk4/D）、15 μM（Cdk5/p25）、3.9 μM（Cdk7/H）］、抗がん作用を示します。細胞周期を G2/M 期で停止させ、カスパーゼの活性化および survivin のダウンレギュレーションによってアポトーシスを誘導することが明らかになっています。また、HeLa、OAW42/e および OAW42/Surv 細胞において、パクリタキセルの細胞毒性およびアポトーシス応答を相乗的に増強します。						
Cdk2/9 Inhibitor [(4-(2-Amino-4-methylthiazol-5-yl)pyrimidin-2-yl)-(3-nitrophenyl)amine]		328.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）	238806-5MG	49,000
	細胞透過性のアミノピリミジニル化合物。Cdk2/E および Cdk9/T1 の強力な ATP 競合阻害剤として作用します（それぞれ K_i=2 nM、4 nM）。高濃度では GSK-3β、Cdk4/D1、Cdk7/H、Cdk1/B、Abl も阻害しますが（それぞれ K_i=20、53、70、80 および 160 nM）、他の 9 種類のキナーゼに対してはほとんど活性を示しません（K_i > 1.0 μM）。細胞の Cdk 基質である pRb および RNA ポリメラーゼ II のリン酸化、ならびに Cdk2 が媒介する S 期への移行を阻害することが示されています。						

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

Cyclin-Dependent Kinase（Cdk）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Cdk9 Inhibitor II [4-(3,5-Diamino-1H-pyrazol-4-ylazo)-phenol]	140651-18-9	218.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	238811-5MG	45,000
有力で ATP 競合の Cdk9 選択的阻害剤として働く細胞透過性アゾ - ピラゾール化合物（IC_{50} = 350 nM、Cdk9/T1 使用）。より高い濃度（各 IC_{50} = 44、20、69、13.5、26、10 μM）のときにのみ Cdk1/B、Cdk2/E、Cdk2/A、Cdk4/D1、Cdk7/H、p70S6K を阻害し、10 μM までの濃度のときでさえ、一般に研究されている他の８つのキナーゼに対してほとんど、あるいはまったく活性を示しません。ヒト腫瘍細胞株において増殖抑制作用を示します。							
Fascaplysin, Synthetic		306.8	≥ 98% by NMR	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Methanol（1 mg/ml）	341251-1MG	22,000
海綿から単離された細胞透過性の赤色色素。Cdk4/D1 に対する強力な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 0.35 μM）。Cdk6/D1 に対する阻害作用ははるかに弱く（IC_{50} = 3.4 μM）、他の各種 Cdk（IC_{50} > 20 μM）およびチロシンキナーゼ（IC_{50} > 10 μM）の活性には影響を与えないことが明らかになっています。生体作用の一部は、DNA へのインターカレーションに起因すると考えられています。また、抗菌作用を示すことが明らかになっています。							
Indirubin Derivative E804 （IDR E804）		365.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	402081-1MG	23,000
細胞膜透過性のインジルビン誘導体（IDR）。Src-Stat3 シグナル経路を阻害し、抗腫瘍特性を示します。 強力な ATP 競合的阻害剤として作用します（Src キナーゼに対して IC_{50} = 430 nM）。また、Cdk1/cylin E（IC_{50} = 210 nM）, Cdk2/cyclin A（IC_{50} = 540 nM）, Cdk1/cyclin B（IC_{50} = 1.65 μM）にも作用します。MDA-MB-468 細胞において Src, JAK1, Stat3 のチロシンリン酸化レベルを用量、時間依存的に低下させます。活性 Stat3 を高レベルに発現している細胞において選択的にアポトーシスを誘導しますが、活性 Stat3 を欠く細胞では誘導しません。本物質のアポトーシス誘導効果は、抗アポトーシス性タンパク質の Mcl-1 と survivin をダウンレギュレーションすることによるものです。							
Meriolin 2 3-((2-Amino)pyrimidin-4-yl)-4-hydroxy-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridine		227.2	≥ 93% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	445820-5MG	39,000
Cdk2/A、Cdk9/T、DYRK1A、Cdk5/p25、CK1δ/ε、Cdk1/B、GSK-3α/β キナーゼ活性（IC_{50} = それぞれ 18、18、35、50、50、57、500 nM）を阻害する細胞透過性の ATP 結合部位を標的とした azaindolopyrimidine 化合物。SH-SY5 神経芽細胞腫培養での DEVDase 活性を誘発（5.46 倍、24 h、1 μM 時）し、SH-SY5Y、多発性骨髄腫 KMS-11、ヒト胎児腎臓 HEK293、結腸直腸腺癌 LS 174T、神経膠腫 GBM 細胞 *in vitro*（IC_{50} = それぞれ 0.41、0.6、0.96、1.06、1.21 μM）に対して抗増殖性活性を示します。							
Meriolin 3		241.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	445821-5MG	39,000
21 種類のほかのキナーゼに対する活動の大幅な減少が示される一方、CDK3/ サイクリン E、CDK4/ サイクリン D1、CDK6/ サイクリン D1、CDK7/ サイクリン H、FLT3（IC_{50} <400 nM）と同様に、CDK9/ サイクリン T、CDK2/ サイクリン A、CDK1/ サイクリン B、CDK5/p25（IC_{50} = それぞれ 6、11、170、170 nM）、DYRK1A、CKIδ/ε 、GSK-3α/β（IC_{50} = それぞれ 29、200、230 nM）のキナーゼ活性を阻害すると報告されている細胞透過性の ATP 部位標的の azaindolopyrimidine 化合物。細胞 CDK 基質のリン酸化反応を効果的に阻害し、SH-SY5Y 神経芽細胞腫培養（有効濃度 0.3 から 1 μM）*in vitro* におけるアポトーシスを誘発し、マウス *in vivo*（1 to 5 mg/kg/day、i.p.）における A4573 ならびに LS174T 由来の腫瘍増殖を遅らせることが示されています。細胞生死判別試験では、Meriolin3 が、通常のヒト包皮線維芽細胞（IC_{50} = 8 μM）と比較して、8 種類の癌株（IC_{50} ≤ 380 nM）のパネルにおける生存能力に選択的に影響を及ぼすことが明らかになりました。							
Olomoucine	101622-51-9	298.3	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）	495620-1MG 495620-5MG	10,900 37,900
[2-(2-Hydroxyethylamino)-6-benzylamino-9-methylpurine]							
$p34^{cdk1}$/ サイクリン B（IC_{50} = 7 μM）の強力かつ選択的なインヒビターとして働くプリン誘導体。また、$p33^{cdk2}$/ サイクリン A（IC_{50} = 7 μM）、$p33^{cdk2}$/ サイクリン E（IC_{50} = 7 μM）、$p33^{cdk5}$/p35（IC_{50} = 3 μM）および p44 MAP キナーゼ（IC_{50} = 25 μM）など、関連するキナーゼも阻害します。キナーゼの ATP 結合ドメインを競合することによって作用します。関連するキナーゼである $p34^{cdk4}$/ サイクリン D（IC_{50} > 1 mM）および $p40^{cdk6}$/ サイクリン D3（IC_{50} > 250 μM）に対しては、低い感度を示します。1 mM では、他のプロテインキナーゼの活性には有意に影響を及ぼしません。インターロイキン 2 で刺激した T リンパ球において DNA 合成を阻害し、インターロイキン 2 を枯渇させた細胞において観察されるものと同様な G_1 期停止を引き起こすことが知られています。また、G_1 期で細胞を同期させるためにも用いられます。							
Olomoucine II		370.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（1 mg/ml）or Ethanol（1 mg/ml）	495621-5MG	42,000
[6-(2-Hydroxybenzylamino)-2-((1R)-(hydroxymethyl)propyl)amino)-9-isopropylpurine]							
Cdk1/B の強力な ATP 競合的阻害剤として働く細胞膜透過性 2,6,9- 三置換プリン類似体（IC_{50}=0.02 μM）。Purvalanol A（製品番号 540500; IC_{50} = 0.05 μM）、Roscovitine（製品番号 557360; IC_{50} = 0.45 μM）、Bohemine（製品番号 203600; IC_{50} = 1.1 μM）および Olomoucine（製品番号 495620; IC_{50} = 7.0 μM）に勝る高い効力を示します。さらに、さまざまながん細胞株において、より大きな *in vitro* 細胞毒性を示します（CEM、MCF7、HOS、G631 および K562 に対して、それぞれ IC_{50} = 3.0 μM、5.3 μM、6.3 μM、6.3 μM および 11.1 μM）。							
InSolution™ Olomoucine		298.3	≥ 98% by HPLC	+4℃		495624-5MG	39,000
DMSO にオロモウシン（製品番号 495620）の 50 mM（5 mg/336 μl）溶液。							
PIM1 Kinase Inhibitor II	491871-58-0	367.2	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO	526520-5MG	24,900
PIM1 Inhibitor III		610.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	526521-1MG	47,000
PIM1 Kinase Inhibitor IV	477845-12-8	322.1	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	526522-5MG	21,000
PIM1/2 Kinase Inhibitor V	327033-36-3	273.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	526523-5MG	17,900
PIM1/2 Kinase Inhibitor VI	587852-28-6	263.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	526524-5MG	17,000

細胞周期・細胞分裂

Cyclin-Dependent Kinase（Cdk）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Purvalanol A	212844-53-6	388.9	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）	540500-1MG	19,900
[2-（1R-Isopropyl-2-hydroxyethylamino）-6-（3-chloroanilino）-9-isopropyl-purine]	細胞浸透性を有する強力な選択的サイクリン依存性キナーゼ（Cdk）阻害物質（Cdc2/cyclin B に対して IC_{50} = 4 nM; Cdk2/cyclin A に対して IC_{50}= 70 nM; Cdk2/cyclin E に対して IC_{50} = 35 nM ; Cdk5/p35 に対して IC_{50} = 75 nM）。						
Roscovitine	186692-46-6	354.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	557360-1MG 557360-5MG	9,900 31,000
[2-（R）-（1-Ethyl-2-hydroxyethylamino）-6-benzylamino-9-isopropylpurine]	サイクリン依存性キナーゼ（Cdk）の強力かつ選択的な阻害剤。Olomoucine（製品番号 495620）に比べ、$p34^{cdk1}$ および $p33^{cdk2}$ に対しては 10 倍、$p33^{cdk5}$ に対しては 20 倍高い効力を示します。$p34^{cdk1}$/ サイクリン B（IC_{50} = 650 nM）、$p33^{cdk2}$/ サイクリン A（IC_{50} = 700 nM）、$p33^{cdk2}$/ サイクリン E（IC_{50} = 700 nM）、および $p33^{cdk5}$/p35（IC_{50} = 200 nM）などのキナーゼの ATP 結合ドメインを競合することによって阻害します。ERK1 および ERK2 などの関連キナーゼに対しては、低い感受性を示します（それぞれ IC_{50} = 34 µM と 14 µM）。Roscovitine は他のプロテインキナーゼ（$p34^{cdk4}$/ サイクリン D1、$p40^{cdk6}$/ サイクリン D2 など）の活性には 100 µM でも有意な影響を及ぼしません。また、細胞周期の G_1/S および G_2/M 期において、Olomoucine に比べ高い抗有糸分裂活性を示します。						
Roscovitine, （S）-Isomer		354.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）	557362-1MG	13,000
[2-（S）-（1-Ethyl-2-hydroxyethylamino）-6-benzylamino-9-isopropylpurine]	強力なサイクリン依存性キナーゼ（Cdk）阻害剤である Roscovitine（製品番号 557360）の（S）-鏡像異性体。$p34^{cdk1}$/ サイクリン B キナーゼを強力に阻害します（IC_{50} = 800 nM）。						
InSolution™ Roscovitine		354.5	≥ 95% by HPLC	+4℃		557364-5MG	39,000
	DMSO にロスコビチン（製品番号 557360）の 5 mM（500 µg/109 µl）溶液。						
SU9516	666837-93-0	241.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	572650-5MG	28,900
{3-[1-（3H-Imidazol-4-yl）-meth-（Z）-ylidene]-5-methoxy-1,3-dihydro-indol-2-one}	細胞透過性の 3- 置換インドリノン化合物。腫瘍細胞において増殖抑制作用およびアポトーシス促進作用を示します。サイクリン依存性キナーゼ（Cdk）に対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します [IC_{50} = 22 nM（Cdk2/A）、40 nM（Cdk1/B）、200 nM（Cdk4/D1）]。PKC、p38、PDGFRβ、および EGFR の活性には著しい影響を与えません（IC_{50} > 10 µM）。Cdk2 に結合し、pRb のリン酸化および pRb と E2F の解離を抑制することによって、増殖因子刺激結腸がん細胞の増殖を阻害します。						
WHI-P180, Hydrochloride	211555-08-7	297.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	681500-500UG 681500-1MG	23,000 35,000
[4-（3'-Hydroxyphenyl）amino-6,7-dimethoxyquinazoline, HCl]	アレルゲンに対する IgE 媒介性マスト細胞反応を *in vitro* および *in vivo* で強力に阻害します。また、ATP 部位をブロックすることによって、サイクリン依存性キナーゼ 2（Cdk2）も阻害します（IC_{50} = 1 µM）。						

DNA / RNA Polymerase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Actinomycin D, *Streptomyces sp.*	50-76-0	1255.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（1 mg/ml）, Methanol, or Chloroform	114666-5MG 114666-1SET	14,000 20,000
（Dactinomycin）	抗腫瘍性抗生物質。デオキシグアノシン残基を介して DNA と複合体を形成することによって、DNA 依存性 RNA ポリメラーゼを阻害します。高濃度においては、DNA ポリメラーゼの阻害作用を示します。また、セリンプロテアーゼの競合的阻害剤としても作用します。同調 HeLa 細胞における細胞増殖およびコロニー形成を阻害します。多くの細胞株における強力なアポトーシス誘導因子です。しかし、アクチノマイシン D は PC12 細胞におけるエトポシド誘導性アポトーシスを抑制することも示されています。						
α-Amanitin, *Amanita sp.*	23109-05-9	919	≥ 90% by absorbance	+4℃	MeOH or H_2O（10 mg/ml）. Reconstitute to a concentration ≥ 1 mM.	129741-1MG	28,000
	キノコから分離された毒性二環式オクタペプチド。動植物を含む高等真核生物における RNA ポリメラーゼ II およびメッセンジャー RNA 合成の強力かつ特異的な阻害剤として作用します。						
Actinomycin D, 7-Amino-	7240-37-1	1270.4	≥ 85% by HPLC	-20℃	DMSO（20 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）. Further dilute in aqueous buffers just prior to use.	129935-1MG	15,000
（7-AAD; 7-Amino-AMD; 7-Aminoactinomycin C_1; 7-Aminodactinomycin）	7- アクチノマイシン D は、その親分子であるアクチノマイシン D と同様に、DNA インターカレーターであり、抗菌特性を有します。ある種の白血病および肉腫に対する増殖阻害活性を示します。蛍光の励起極大および発光極大は、それぞれ 500 nm および 672 nm です。DNA と複合体を形成し、555 nm での吸光および 655 nm での発光を示します。膜の完全性を失った初期アポトーシス細胞をアポトーシス細胞および生存細胞から識別するために有用です。DNA 解析に使用されており、染色体の構造・機能研究用のプローブとしても使用されています。						
Aphidicolin	38966-21-1	338.5	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）, Ethanol, or Methanol	178273-1MG	21,900
	細胞周期同調剤として作用する、四環式ジテルペン系抗生物質。細胞周期を S 期で停止させます。真核細胞および一部のウイルスにおいて、DNA ポリメラーゼおよびを特異的に阻害します。白血病細胞株におけるアラビノシルヌクレオシド誘導性アポトーシスを増強します。また、HeLa S3 細胞においてアポトーシスを誘導しますが、p53 陰性ヒト前立腺がん細胞株 PC-3 におけるピンクリスチン誘導性アポトーシスを阻害します。						
DNA Polymerase Sliding Clamp Inhibitor, RU7	355400-87-2	497.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	260930-25MG	30,000
E. coli Pol III/-clamp Interaction Inhibitor	*E. coli* クランプのペプチド結合ポケットを結合し、クランプに結合している *E. coli* DNA ポリメラーゼ III を破壊するが、グラム陽性の化膿連鎖球菌種のクランプへの Pol C の結合は破壊しない 2 チオチアゾリジンジオン化合物。*E. coli* Pol I クレノウ断片の依存活性やサッカロミセス cereviase 種の酵母菌 PCNA 依存性 Pol 活性に対しほとんど影響を及ぼさない一方、依存性レプリカーゼアッセイにおいて Pol II や IV ではなく *E. coli* Pol III（K_i = 10 M）のポリメラーゼ活性を選択的に阻害することを示しています。						
Novobiocin, Sodium Salt	1476-53-5	634.6	≥95% by elemental analysis（based on nitrogen）	+4℃	H_2O（100 mg/ml）	491207-1GM 491207-10GM	7,000 40,000
	正のスーパーコイル DNA の生成に使われる DNA ジャイレースの阻害剤。レトロウィルス RNA 依存性 DNA ポリメラーゼを阻害します。また、ADP リボシル化を強力に阻害し、大腸菌から野性型 pMG110 プラスミドを排除します。						

DNA / RNA Polymerase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Rifampicin	13292-46-1	823	≥ 97% by HPLC (dry basis)	room temp.	DMSO (25 mg/ml) or Methanol (25 mg/ml)	557303-1GM	14,000
						557303-5GM	61,000
[3-(4-Methylpiperazinyliminomethyl)rifamycin SV; Rifampin]	不活性な複合体を形成することにより、バクテリアの DNA 依存性 RNA ポリメラーゼを特異的に阻害する抗生物質。哺乳類 RNA ポリメラーゼには影響を与えません。初期転写複合体が伸長モードに入るのを妨げることにより、転写を阻害します。						
RNA Polymerase III Inhibitor		452.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (15 mg/ml). Slight warming may be necessary to achieve complete solubilization.	557403-10MG	42,900
{N-[1-(3-(5-Chloro-3-methylbenzo[b] thiophen-2-yl-1-methyl-1H-pyrazol-5-yl)]-2-chlorobenzenesulfonamide; ML-60218}	細胞透過性のイミダゾロ - スルホンアミド化合物。RNA ポリメラーゼ III に対するスペクトルの広い阻害作用を示します [IC_{50} = 27 M (ヒト RNA Pol III)、32 M (*S. cerevisiae*RNA Pol III)]。RNA Pol III による tRNA 転写を抑制することによって酵母の細胞増殖を阻害します。						
Zebularine	654065	228.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml). Slight warming may be required to achieve complete solubilization.	691400-10MG	33,000
						691400-25MG	70,000
[2-Pyrimidone-1--D-riboside; 1-(-D-Ribofuranosyl)-1,2-dihydropyrimidin-2-one]	化学的に安定なシチジンアナログで、抗腫瘍活性を示します。シチジンデアミナーゼの遷移状態アナログとしてこれを阻害し、活性部位に共有結合で結合します。また *in vivo*、*in vitro* において DNA のメチル化を阻害して腫瘍の生育を阻害します。						

DNA Methyltransferase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
5-Aza-2'-Deoxycytidine	2353-33-5	228.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml), 50% Acetic Acid (25 mg/ml), or Methanol (1 mg/ml) (warming is required to achieve complete solubilization)	189825-25MG	51,900
(5-Aza-CdR; 5-Aza-dC; 5-Deoxy-2'-azacytidine)	DNA メチルトランスフェラーゼ阻害剤として働くシトシン類似体。カスパーゼ 8 ならびにカスパーゼ 10 の mRNA とタンパク質発現、ならびに TRAIL 耐性細胞株における TRAIL (リガンドを含む腫瘍壊死因子関連アポトーシス) 感度を回復します。また、HDAC (ヒストンデアセチラーゼ) 阻害剤に誘発されたアポトーシスを強化します。						
DNA Methyltransferase Inhibitor		334.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or Methanol	260920-10MG	36,900
[2-(1,3-Dioxo-1,3-dihydro-2H-isoindol-2-yl)-3-(1H-indol-3-yl)propionic acid; RG108]	抗増殖性を示す細胞透過性のフタルイミドトリプトファン含有プロピオン酸化合物。DNA メチルトランスフェラーゼの特異的阻害剤として働きます (CpG メチラーゼ M.SssI に対する IC_{50}=115 nM)。酵素の活性部位を直接標的として DNA メチル化を阻害し、腫瘍抑制遺伝子を再活性化することが示唆されています。						
(-) -Epigallocatechin Gallate	989-51-5	458.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO or H_2O (5 mg/ml)	324880-10MG	11,000
[EGCG; (2R,3R)-2-(3,4,5-Trihydroxyphenyl)-3,4-dihydro-1[2H]-benzopyran-3,5,7-triol-3-(3,4,5-trihydroxybenzoate)]	緑茶の主要ポリフェノール成分の 1 つ。強力な抗腫瘍作用、抗炎症作用、および抗酸化作用を示します。細胞周期を G_0/G_1 期で停止させ、用量依存的にアポトーシスを誘導します。PMA 誘発皮膚肥厚を阻害し、プロテインキナーゼ C を活性化することが示されています。オルニチンデカルボキシラーゼおよびインターロイキン -1α の mRNA およびタンパク質の発現も活性化します。誘導型一酸化窒素合成酵素 (iNOS) の遺伝子発現および酵素活性の阻害剤として作用します。また、ペルオキシ亜硝酸を介した 8- オキソデオキシグアノシンおよび 3- ニトロチロシンの生成を抑制します。無細胞系および癌細胞株において、テロメラーゼを強力かつ直接的に阻害します。						
InSolution™ Sinefungin	58944-73-3	381.4	≥ 95% by HPLC	-20℃		567051-2MG	38,000
(A9145; Adenosyl-ornithine; SF)	S- アデノシル -L メチオニン (SAM、AdoMet) メチルトランスフェラーゼ特異的阻害剤として働く抗リーシュマニアヌクレオシド抗生物質。						

細胞周期・細胞分裂

Histone Acetylase and Deacetylase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Anacardic Acid	16611-84-0	348.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml), Ethanol (10 mg/ml), or Methanol (10 mg/ml)	172050-10MG	22,900
(AA; 2-Hydroxy-6-pentadecylbenzoic Acid; 6-Pentadecylsalicylic Acid)	細胞透過性のシアル酸誘導体で p300、PCAF (p300/CBP-associated factor) histone acetyltransferase (HAT) にそれぞれ IC_{50} 約 8.5 μM、約 5 μM で強力に阻害します。HAT 依存性のクロマチンからの転写を阻害するが、DNA の転写そのものは阻害しないことが知られています。他にもさまざまな生物活性を有し、抗菌性、抗真菌性、プロスタグランジン合成阻害、チロシナーゼ阻害、リポオキシゲナーゼ阻害を示します。						
Apicidin, *Fusarium sp.*		623.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml) or Ethanol	178276-1MG	25,900
						178276-5MG	62,000
{*cyclo*-[L-(2-Amino-8-oxodecanoyl)-L-(N-methoxytryptophan)-L-isoleucyl-D-pipecolinyl]}	真菌の代謝産物。寄生虫のヒストンデアセチラーゼ (IC_{50} = 700 pM) および *in vitro* HeLa 細胞増殖 (IC_{50} = 50-100 nM) の強力な阻害剤として作用する抗原虫剤です。$p21^{WAF1}$ の可逆的な転写活性化を誘導します。また、H-*ras* による MCF10A 細胞の侵襲性表現型の誘導を抑制します。これは、MMP-2 のダウンレギュレーションによるものである可能性があります。						
Epigenetic Multiple Ligand		623.9	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	324888-10MG	28,000
3,5-bis(3,5-Dibromo-4-hydroxybenzylidene)-tetrahydro-2H-pyran-4-one	エピジェネティックな複合的なリガンド (epi-ML) として働き、H4/PRMT1 (91% 阻害、50 μM 時)、H4/RmtA (50% 阻害、29μM 時)、H3/p300/CBP (61% 阻害、50μM 時)、PABP1/CARM1 (>90% 阻害、100μM 時)、H3/SET7 (>90% 阻害、100 μM 時)、SIRT1/2 (>50% 阻害、25 μM時) を含む複数のクロマチン関連酵素より処理された基質を阻害する細胞透過性の bis-arylidene 化合物。U937 細胞集団の中でアポトーシス (28%、25 μM 阻害剤で 30 h 培養後) あるいは顆粒球への分化 (非アポトーシス性細胞 100%、5μM 阻害剤で 30 hr 培養後) のどちらかを誘発することを示しています。						
Ginkgolic Acid (15:1)	22910-60-7	346.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) or Ethanol (100 mg/ml)	345887-5MG	36,900
	細胞透過性の anacardic acid (製品番号 172050) のアナログ。SUMO 活性化酵素 E1 (製品番号 662073 および 662074) を選択的標的とし、E1 の活性部位のシステインとは独立に E1-SUMO 中間体形成を妨害することにより、タンパク質の SUMO (製品番号 662037,662039, および 662042) による修飾を ATP- 依存的に阻害します (基質として RanGAP1-C2 を用いた場合 IC_{50} = 3.0μM)。ginkgolicacid および anacardic acid はいずれも、p53 を含めた 293T 細胞タンパク質の総 SUMO 化を用量依存的かつ効果的に減少させることが判明している一方、293T 培養における総細胞タンパク質のユビキチン化やヒストン H4K8 のアセチル化には影響しません。ただし、いずれの化合物も無細胞アセチラーゼ活性測定において PCAF (製品番号 124026) によるヒストンのリジンのアセチル化を阻害することが判明しています。						
Histone Acetyltransferase Inhibitor II	932749-62-7	464.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml) or Ethanol (10 mg/ml)	382110-10MG	32,900
2,6-bis-(3-Bromo-4-hydroxybenzylidene) cyclohexanone	細胞透過性のビス - アリリデンシクロヘキサノン化合物。p300/CBP 選択的ヒストンアセチルトランスフェラーゼ阻害剤として作用し (IC_{50} = 5 μM)、はるかに高い濃度でのみ GCN5 および PCAF に影響を与えます (5 μM 阻害剤濃度で 30% および 0% 阻害)。HeLa 細胞においてヒストン H3 アセチル化を抑制し ($IC_{50} \leq 40$ μM)、クロマチン凝縮を誘導することが知られています。						
Histone Acetyltransferase Inhibitor IV, CPTH2	357649-93-5	291.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	382111-10MG	26,900
Cyclopentylidene-(4-(4'-chlorophenyl) thiazol-2-yl) hydrazone	rhGcn5 自己アセチル化に対してほとんど活性を見せない一方、基質競合的に組換えヒトヒストン Gcn5 によって H3 のアセチル化を阻害する細胞透過性のチアゾリルヒドラゾン化合物。遺伝子欠失あるいは CPTH2 処理により出芽酵母における Gcn5 の機能的ノックアウトは出芽酵母の生存において有害ではありませんが、CPTH2 処理は、Elp3 あるいは Sas2 から除去された菌株ではなく Gcn5 から遺伝的に除去された酵母菌株の成長を阻害することが示されています。						
Histone Acetyltransferase p300 Inhibitor, C646		445.42	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	382113-10MG	20,900
4-(4-{[5-(4,5-dimethyl-2-nitrophenyl) furan-2-yl]methylidene}-3-methyl-5-oxo-4,5-dihydro-1H-pyrazol-1-yl) benzoic acid	p300 Lys-CoA 結合ポケットをめぐってアセチル -CoA と競合する、可逆的で細胞透過性のピラゾロン p300/CBP HAT 阻害剤 (K_i = 400 nM)。この化合物は、10 nM のとき P300 に対して 86%阻害することを示していますが、化学スクリーニングアッセイにおいてセロトニン N- アセチルトランスフェラーゼ、PCAF ヒストンアセチルトランスフェラーゼ、GCN5 ヒストンアセチルトランスフェラーゼ、Rtt109 ヒストンアセチルトランスフェラーゼ、Sas ヒストンアセチルトランスフェラーゼ、MOZ ヒストンアセチルトランスフェラーゼに対しては 10%以下の阻害しか引き起こしません。25 μM の化合物で C3H 10T1/2 マウス fibroblast の処理は、ヒストン H3 と H4 の基礎的 TSA 誘発性アセチル化を導きます。また、25 μM のペプチドベースの二基質 p300/CBP HAT 阻害剤 Lys-CoA-Tat と比べて、有効性が同等か高いレベルで、10 μM のメラノーマならびに非小細胞肺がんのがん細胞株におけるヒト細胞増殖を阻害することが示されています。						
HistoneAcetylTransferase Inhib VII CTK7A				-20℃	DMSO	382115-10MG	28,900
Histone Deacetylase Inhibitor II		222.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	382148-5MG	35,000
(*m*-Carboxycinnamic Acid bis-Hydroxamide; CBHA)	ヒストンデアセチラーゼ (HDAC) 阻害剤として作用する第二世代ハイブリッド極性物質。HDAC の阻害は、ヒドロキサミン基の活性部位と亜鉛との結合により起こると考えられています。形質転換細胞の成長停止および終末分化を強力に誘導することが示されています (約 4 μM)。ヒト神経芽細胞のアポトーシスおよび CD95/CD95 リガンド発現を誘導します。						
Histone Deacetylase Inhibitor III		307.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml)	382149-1MG	25,900
						382149-5MG	78,000
[4-Dimethylamino-*N*-(6-hydroxycarbamoylhexyl) benzamide; *N*-Hydroxy-7-(4-dimethylaminobenzoyl) aminoheptanamide; M344]	ヒストンデアセチラーゼを強力に阻害する Trichostatin A (製品番号 647925) のアミドアナログ (ラット肝 HDAC に対して IC_{50} = 40 nM、トウモロコシ HD に対して IC_{50} = 100 nM)。マウス赤白血病細胞の分化を誘導し、増殖を阻害します (約 2 μM)。						
Histone Deacetylase Inhibitor IV		325.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	382170-10MG	50,900
[N^1-(2-Aminophenyl)-N^7-phenylheptanediamide]	細胞透過性のピメロイルアニリド化合物。FXN-(フラタキシン遺伝子) 特異的 HDAC (ヒストンデアセチラーゼ) 阻害剤として作用します。H3K9、H4K8 および H4K16 のアセチル化には著しい変化を与えずに H3K14、H4K5 および H4K12 のアセチル化を促進することによって、ヒストン H3 および H4 の低アセチル化による FRDA (Friedreich 失調症) 細胞における FXN 転写のサイレンシングを逆転させます (初代 FRDA リンパ球において 5 μM で FXN mRNA が約 3 倍増加、2.5 μM で FRDA 細胞株に約 3 倍のフラタキシンが発現)。これに対し、汎用されている他の 2 つの HDAC 阻害剤、Trichostatin-A (製品番号 647925 および 647926) および SAHA は FXN 転写に対する作用を示しません。						
Histone Deacetylase Inhibitor VI, HNHA	926908-04-5	303.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or Methanol (10 mg/ml)	382172-10MG	39,900
N-Hydroxy-7-(2-naphthylthio) heptanomide	ヒドロキシアミドベースの細胞透過性 SAHA 類縁体。ヒストン脱アセチル酵素 (HDAC) 活性を強力に阻害します (IC_{50} = 100 nM)。ヒト線維肉腫 HT1080 細胞でヒストンのアセチル化と p21 転写を誘導し、同時に細胞周期の進行を阻害することが示されています。ネズミ異種移植 *in vivo* モデルで、SAHA よりも腫瘍増殖を強力に阻止することが報告されています。						
Histone Deacetylase Inhibitor VII, 106	937039-45-7	339.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (2.5 mg/ml)	382173-5MG	31,900
Pimelic Diphenylamide 106	ヒストン脱アセチル酵素阻害剤 IV (製品番号 382170) の p- トリルベンザミド類縁体。細胞透過性。HDAC クラス I の低速かつ可逆性の競合阻害剤で、活性部位 Zn^{2+} に強く結合します (HDAC1、3、2、8 の IC_{50} = 150 nM、370 nM、760 nM、5 μM、HDAC1、3 および 2 の K_i = 148、14 および 102 nM)。GM15850 FRDA リンパ芽球細胞で、ヒストンのアセチル化を延長し、フラタキシンタンパク質濃度を有意に高めます。HDAC 阻害剤 SAHA は、fast-on/fast-off 競合阻害剤であることが示されています (HDAC1 および 3 の K_i = 5.4 および 7.8 nM)。						

Histone Acetylase and Deacetylase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Histone Deacetylase Inhibitor VIII 1-dimethylethylester	1045792-66-2	446.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	382175-1MG	23,900
	有効で非常に選択的な HDAC6 阻害剤（HDAC-6、-3、-10、-2、-1、-8 に対して IC_{50} = それぞれ 0.002、0.42、90.7、252、271 、6851 nM）として働く細胞透過性の活性部位 Zn^{2+} を標的にした phenylisoxazolo- ヒドロキサメート。膵臓がん細胞株（IC_{50} <1.0 μM）のパネルの希釈を阻害する上で SAHA よりも有効であることを示しています。						
HDAC Inhibitor XIX, Compound 2 1-Naphthohydroxamic Acid	6953-61-3	187.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	382177-50MG	13,900
	細胞透過性アリルヒドロキサメート化合物。 20 μM の高濃度でも培養 BE（2）-C の全体 H4 アセチル化レベルに影響を与えることなく、クラス I HDAC1 およびクラス II HDAC6（IC_{50} >100 μM）よりも、HDAC8（IC_{50} = 14 μM）の活性を選択的に阻害します。神経芽細胞腫培養物での Compound 2（10 ～ 40 μM）または siRNA による HDAC8 のダウンレギュレーションによって、神経突起様形態的変化を伴う成長阻害が発生することが報告されています。HeLa および HEK 293 培養物のチューブリンアセチル化を有効に促進することから、チューブリンアセチル化の調節のために、HDAC6 以外の代替細胞酵素を標的にできることが分かります。						
HDAC Inhibitor XXIV, OSU-HDAC-44 OSU-HDAC-44		326.39	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml)	382181-10MG	31,900
	濃度 1 μM のとき、コントロールと比較してクラス I（HDAC1 ならびに HDAC8）、クラス II（HDAC4 ならびに HDAC6）、クラス IV（HDAC11）HDACs の活性を、SAHA に相当あるいは SAHA よりも阻害効果が高い最大 90% 未満の抑制をすることが見られる細胞透過性フェニルブチレートヒドロキサメート pan-HDAC 阻害剤。この化合物は *in vitro* で NSCLC 細胞において広範囲に抗腫瘍活性を示し、細胞の生存性の低減においてシスプラチンと相乗効果を持ち、内因性のアポトーシス経路の誘発に関わっており、有糸分裂と細胞質分裂に対して阻害的な効果を示します。この阻害剤はまた、体重や検出可能な毒性に悪影響を及ぼすことなく、マウス genograft モデルの腫瘍成長をそれぞれ 7.5、15、30 mg/kg のときに 62%、78%、90% 抑制することが示されています。						
ITSA1 [N-(1H-Benzotriazol-1-yl)-2,4-dichlorobenzamide; Inhibitor of Trichostatin A 1]	200626-61-5	292.1	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	419840-25MG	22,000
	細胞透過性のベンゾチアゾールアミド。ヒストンデアセチラーゼ HDAC および微小管アセチラーゼ TDAC 阻害剤と共同して阻害します。細胞の転写、分化、細胞周期、アポトーシスにおけるアセチル化の機能研究に有用です。TSA（Trichostatin A; 製品番号 647925）とタキソール taxol に対する本 ITSA1 の作用の違いから、ヒストンデアセチラーゼ HDAC/ 微小管アセチラーゼ TDAC 阻害剤と本剤はことなるメカニズムで作用していることが A549 細胞にて報告されています。TSA（Trichostatin A）の *in vivo* での良好な成果からロドプシン -GFP 遺伝子導入したゼブラフィッシュ眼での発現はヒストンの可逆的なアセチル化によって制御されていることが報告されています。ヒストンアセチルトランスフェラーゼは修飾しません。また HDAC の発現量にも影響しません。						
InSolution™ Leptomycin B, *Streptomyces sp.* (LMB)	87081-35-4	540.7	≥ 95% by HPLC	-70℃		431050-5UG	48,000
	抗かび性抗生物質の 1 種で、核輸送因子 CRM1 に結合し不活化し、核輸送を阻害します。Rev の移送阻害にレプトマイシン A（製品番号 431051）の 2 倍強力な阻害活性を持ちます。Rev 依存性の mRNA の細胞質への移出をブロックします。ヒト単球での HIV-1 複製を抑制します（IC_{50}= 600 pM）。また、レプトマイシン B（LMB）は健常 ファイブロブラストで核内 p53 の蓄積を効率的に誘導し、また Mdm2 を介する p53 のユビキチン化と分解を抑制します。						
LSD1 Inhibitor	927019-63-4	474.34	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O	489476-10MG	36,900
LSD1 Inhibitor II, S2101 S2101		311.75	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or H_2O (25 mg/ml)	489477-5MG	29,900
	LSD1（IC_{50} = 0.99 μM、KI = 0.61 μM、kinact/KI = 4560 M-1S-1）に対してメカニズムベースの阻害を引き起こし、MAO-B（KI = 17 μM、kinact/KI = 18 M-1S-1）ならびに MAO-A（KI = 110 μM、kinact/KI = 60 M-1S-1）に対してより低い阻害活性を示す、2-PCPA（製品番号 616431）（IC50 = 184 μM、KI = 100 μM、kinact/KI = 58 M-1S-1 f または LSD1、K I = 26 μM、kinact/KI = 271 M-1S-1 f または MAO-B、K I = 5 μM、kinact/KI = 1050 M-1S-1 f または MAO-A）と比較してより高い有効性と選択性の細胞透過性 2-PCPA 誘導体。LSFD1 の阻害は、S2101 を使った HEK293T ヒト細胞の治療は H3K4me2 のレベルにおいて用量依存的な増加に至ることが、細胞ベースアッセイにおいて再確認され、また 2-PCPA. と比較して約 50 倍強い阻害を示しています。						
InSolution™ Ratjadone A, Synthetic (Ratjadon)	163564-92-9	456.6	≥ 95% by HPLC	-70℃	Methanol (20 mg/ml) or aqueous buffers (≤ 100 μM)	553590-2UG	55,000
	細胞透過性のポリケチドで強力な抗腫瘍活性を示します。もともとミクソバクテリア *Spodoptera frugiperda* の代謝産物で酵母および糸状菌に対する抗生物質として同定されました。Ratjadone 類は ロイシンリッチ核輸出シグナル LR-NES（leucine rich-nuclear export signal）を含むタンパク質を、CRM1 に共有結合して阻害します。細胞増殖を阻害し（IC_{50} <1 ng/ml）、細胞周期を G_1 で停止させます。						
SBHA (Suberic Bishydroxamate; Suberoyl Bishydroxamic Acid)	38937-66-5	204.2	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	559418-100MG	21,900
	ビスヒドロキサン酸のヒストン脱アセチル酵素（HDAC）阻害剤で、抗腫瘍作用を有します。MEL 細胞でアセチル化されたヒストン H 4 を増加させ、ヒト HDAC1 および HDAC3 活性を阻害します（ID_{50} 約 250 - 300 nM）。両極性化合物で、がん化した細胞の分化を誘導しアポトーシスを誘導します。ケラチノサイトおよび 扁平上皮がんの増殖を阻害します（それぞれ IC_{50} = 11.57 μM、5.39 μM）。						
Scriptaid [CGK1026; 6-(1,3-Dioxo-1*H*,3*H*-benzo[*de*] isoquinolin-2-yl)-hexanoic Acid Hydroxyamide]		326.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (4 mg/ml)	565730-5MG	27,900
	比較的、非毒性のヒドロキサム酸含有ヒストンデアセチラーゼ（HDAC）阻害剤。安定および一過性の受容体測定法において、濃度依存的に転写活性化（TGFβ/Smad4）を促進します。約 2 μg/ml（6-8 μM）の濃度で、PANC-1 細胞のヒストンアセチル化を 100 倍以上増加させます。						
Sirtinol {2-[(2-Hydroxynaphthalen-1-ylmethylene) amino]-N-(1-phenethyl) benzamide; Sir Two Inhibitor Naphthol}		394.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml)	566320-5MG	45,900
	Sirtuin クラスの脱アセチル化酵素活性の特異的かつ直接的な阻害剤として作用する、細胞浸透性 2- ヒドロキシ -1- ナフトアルデヒド誘導体。ヒトの HDAC1 には、まったく影響を及ぼしません。*in vivo* で Sir2p の転写サイレンシング活性を阻害し（IC_{50} = 25 μM）、*in vitro* で精製した組換え酵母 Sir2p およびヒト SIRT2 の NAD 依存性ヒストンデアセチラーゼ活性を阻害することが報告されています（それぞれ、IC_{50} = 70 μM および 40 μM）。						
InSolution™ Sirtinol {2-[(2-Hydroxynaphthalen-1-ylmethylene) amino]-N-(1-phenethyl) benzamide; Sir Two Inhibitor Naphthol}		394.5	≥ 97% by HPLC	+4℃		566321-1MG	16,900
	DMSO にサーチノール（製品番号 566320）の 10 mM（1 mg/254 μl）溶液。						
SIRT1 Inhibitor III	49843-98-3	248.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	566322-5MG	48,900
SIRT1/2 Inhibitor IV, Cambinol	14513-15-6	360.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	566323-5MG	38,000

細胞周期・細胞分裂

Histone Acetylase and Deacetylase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
SIRT2 Inhibitor, AGK2	304896-28-4	434.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (2.5 mg/ml) . Slight warming may be required for complete solubilization.	566324-5MG	34,900
[2-Cyano-3-(5-(2,5-dichlorophenyl)-2-furanyl)-N-5-quinolinyl-2-propenamide]	細胞透過性のキノリン化合物。sirtuin2 の選択的かつ可逆的なニコチンアミド様阻害剤として作用します（SIRT2、SIRT1 および SIRT3 に対する IC_{50} = 3.5 μM, > 50 μM および > 50 μM）。封入体の形成を促進し、パーキンソン病モデルにおける α-Syn 凝集を刺激して、α- シヌクレインを介した毒性を低減して神経保護をします。						
SIRT1 Inhibitor IV, (S)-35	848193-72-6	262.7	≥ 96% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	566325-500UG	18,000
(6S)-2-Chloro-5,6,7,8,9,10-hexahydro-cyclohepta[b]indole-6-carboxamide	SIRT1 阻害剤 III（製品番号 566322）と構造的に類似し、同様の効力（IC_{50} = 63 nM）選択性とを示す細胞透過性の鏡像異性的に純水化合物。マウス *In vivo* の 94 分の血中半減期で経口投与が可能なことを示しています。						
SIRT2 Inhibitor, Inactive Control, AGK7	304896-21-7	434.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	566326-5MG	34,900
	SIRT2 Inhibitor, AGK2（製品番号 566324）の細胞透過性構造異性体で、sirtuins 1 および sirtuins 2（SIRT3, SIRT1, SIRT2 の IC_{50} は、それぞれ >5 μM、>50 μM 、>50 μM）よりも sirtuins 3 を選択的に阻害します。α-Syn-H4 細胞での α-synuclein を介した毒性、α-Syn の凝集のいずれにもほとんど影響を与えません。						
SIRT1/2 Inhibitor VII	143034-06-4	282.3	≥ 95% by NMR	+4℃	DMSO (3 mg/ml)	566327-10MG	16,000
5-(2-Naphthylidine)-2-thiobarbituric acid	チオバルビツール酸化合物。hSIRT1 および hSIRT2 の NAD^+ 依存性脱アセチル化酵素活性の強力かつ可逆的なニコチンアミド競合阻害剤として作用します（IC_{50} はそれぞれ 13.2 および 9.1 μM）。						
SIRT1/2 Inhibitor VIII, Salermide	1105698-15-4	394.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	566330-10MG	28,000
SIRT2 Inhibitor II, AK-1		403.45	>95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	566331-10MG	21,900
	SIRT2 ニコチンアミド結合部位を標的にすることで SIRT2 活性（酵素アッセイを通して IC_{50}= 12.5 >M）を阻害しますが、有効性の低い SIRT1 ならびに SIRT3（IC_{50} >40 μM）も標的にする可能性もある細胞透過性のベンジルスルホンアミド。ウェスタン解析は、AK-1（> 25 μM）による処理はアセチルチューブリンにおける増加に繋がることを示します。AK-1（1 から 10 μM）は、Dropshila ならびにシノラブディス・エレガンスおけるハンチントン病（HD）の 2 つの *in vivo* モデルにおける神経機能障害をレスキューすることを示しています。また、遺伝的 SIRT2 阻害のそれに類似した 1 μM から 4 μM の HD の第一次モデルにおける神経毒性の回復を示しており、ステロール生合成の負の調節にも関係しています。						
Splitomicin	1384339	198.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	567750-5MG	28,000
(1,2-Dihydro-3H-naphtho[2,1-b]pyran-3-one)	β- ナフトール由来の細胞浸透性ラクトン。Sir2 タンパク質の NAD^+ 依存性ヒストンデアセチラーゼ（HDAC）活性に対する選択的阻害剤として作用します（IC_{50}=60 μM）。						
SRT1720	925434-55-5	469.6	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO	567860-10MG	48,900
Tenovin-1	380315-80-0	369.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	580566-10MG	18,000
N-(4-tert-Butylbenzoyl)-N'-(4-acetylaminophenyl)-thiourea	p53 を活性化し、抗腫瘍特性を呈する細胞膜透過性ベンゾイルチオ尿素化合物。サーチュイン 1 および 2 を可逆的かつ非競合的に阻害し（SIRT2 の IC_{50} = 約 10 μM）、HDAC よりも選択性が高いです。数種の細胞系および異種移植マウスモデル（92mg/kg の腹腔内投与）で、MDM2 による p53 の分解を阻止し、細胞死を誘導して、腫瘍の増殖を遅延させることが示されています。						
Trichostatin A, *Streptomyces sp.*	58880-19-6	302.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (20 mg/ml) , ethanol (1 mg/ml) , or methanol	647925-1MG	41,900
(4,6-Dimethyl-7-[*p*-dimethylaminophenyl]-7-oxahepta-2,4-dienohydroxamic Acid; TSA)	ヒストン・デアセチラーゼの可逆的で強力な阻害剤。HeLa 細胞の細胞周期進行を G_1 期でブロックし、細胞内グルゾリン量を 12 倍増加させます。発がん性 *ras* 形質転換 NIH/3T3 細胞の正常形態への復帰を誘導。Jurkat 細胞において IL-2 遺伝子の発現を阻害し（IC_{50} = 73 nM）、マウスモデルにおいて免疫抑制活性を示します。また、Hep 3B 細胞において $p57^{kip2}$ をダウンレギュレートします。						
InSolution™ Trichostatin A, *Streptomyces sp.*		302.4	≥ 98% by HPLC	-20℃		647926-500UG	25,900
	DMSO にトリコスタチン A、ストレプトマイセス sp.（製品番号 647925）の 10 mM（500 μg/165 μl）溶液。						
Valproic Acid, Sodium Salt	1069-66-5	166.2	≥ 98% by titration	+4℃	H_2O (50 mg/ml)	676380-5GM	12,900
(2-Propylpentanoic Acid, Na)	細胞浸透性短鎖脂肪酸。抗てんかん薬および抗躁うつ病薬として作用します。						

Histone Methylation and Demethylation 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
CARM1 Inhibitor		555.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	217531-10MG	58,900
Histone Lysine Methyltransferase Inhibitor	935693-62-2	490.6	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (10 mg/ml)	382190-5MG	35,000
2-(Hexahydro-4-methyl-1H-1,4-diazepin-1-yl)-6,7-dimethoxy-N-(1-(phenylmethyl)-4-piperidinyl)-4-quinazolinamine	細胞透過性を有するジアゼピニル - キナゾリンアミン化合物。G9a HMT アーゼ活性に対する可逆的 SAM（S- アデノシルメチオニン）非競合型阻害薬として作用します（IC_{50}=2.7 μmol/L ）。他の HMT アーゼ、つまり GLP（IC_{50}=38 μmol/L）、SUV39H1（H320R）、PRMT1、SET7/9、EST（IC_{50}>45 μmol/L）と比較した場合、G9a HMT アーゼ活性に対して選択性を示します。マウス ES 細胞、MEF 細胞、HeLa 細胞において H3K9me2 レベルを低下させ、さらに Oct3/4-Klf4 形質導入 NPC において初期化効率を増強させます。						
HMTase Inhibitor II, Chaetocin	28097-03-2	696.9	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (1 mg/ml)	382191-500UG	27,900
	マウス G9a あるいはアカパンカビ DIM5 H3K9 HMT（IC_{50} = それぞれ 2.5 ならびに 3 μM）に対して有効性が低くなり、ショウジョウバエ E (z) の H3K27 HMTase 活性や、細菌性 SET7/9 の H3K4 活性あるいは細菌性 PRSET7 の H4K20 活性に対して活性がない一方、キイロショウジョウバエ SU（VAR）3-9 の H3K9 ヒストンメチルトランスフェラーゼ活性とヒトホモログ SUV39H1（IC_{50} = それぞれ 600 ならびに 800 nM）を SAM- 競合的に有効的に阻害する自然に起きる細胞透過性ケトミウム真菌エピ - ジチオ - ジケトピペラジン。Chaetocin の分子内ジスルフィド結合の減少は無細胞酵素アッセイにおいて HMTase 阻害活性に影響を及ぼしませんが、ジスフィルド結合の完全性は細胞吸収に必要不可欠です。患者から分離された骨髄細胞や骨髄腫細胞株は、薬剤によって誘発された細胞酸化的ストレスに対して過敏になっているため H_2O_2 あるいは Chaetocin 治療の際に特に細胞死を起こしやすくなることが示されています。						
HMTase Inhibitor VI, BRD4770			≥ 98% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	382194-10MG	28,900
JMJD2 Inhibitor, 5-carboxy-8HQ	5852-78-8	189.17	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	420201-5MG	39,000

Microtubule Assembly 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Tubulin Polymerization Inhibitor II	1151995-69-5	341.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	654164-5MG	24,000

Nuclease 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Aurintricarboxylic Acid	4431-00-9	422.4		room temp.	0.1 M NaOH (35 mg/ml)	189400-100MG	10,900
(ATA)	ポリアニオン性の多芳香族化合物。タンパク質・核酸複合体の形成に依存する細胞プロセスの強力な阻害剤として使用されています。様々な要因によって誘導される様々な細胞タイプにおけるアポトーシス性細胞死を阻害することが示されています。ATA は、DNA トポイソメラーゼ II の強力な阻害剤であり、血管新生の強力な阻害剤としても作用します。フォン・ウィルブランド因子の血小板への結合を阻害し、グルタミン酸誘発神経損傷を抑制します。最近、ATA が MAP キナーゼ、Shc タンパク質、フォスファチジルイノシトール 3- キナーゼ、およびフォスフォリパーゼ Cγ のチロシンリン酸化を促進することが報告されています。カルパインの主なアイソフォームの両方を阻害します（IC_{50} = 22 μM and IC_{50} = 10 μM for μ-calpain and m-calpain, respectively）。						
DNA Base Excision Repair Pathway Inhibitor	6960-45-8	206.2	≥ 95% by titration	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	262015-25MG	22,900
(CRT0044876; 7-Nitroindole-2-carboxylic acid)	細胞透過性のニトロインドールカルボキシレート。DNA 修復酵素 APE1（ヒトのアプリン / アピリミジン・エンドヌクレアーゼ）の特異的かつ強力な非毒性阻害剤として作用します（IC_{50}= 約 3 μM）。APE1 の活性部位を標的として、APE1 の 3′- ホスホジエステラーゼおよび 3′- ホスファターゼ活性を阻害することが示されています。エンドヌクレアーゼ IV、制限酵素 BamH1、トポイソメラーゼ I に対しては 100 μM でもほとんど影響を与えません。さらに、いくつかの DNA 傷害物質による細胞毒性を強化します（例えば、HeLa、HT1080 および MDA-MB-231 細胞では MMS、Temozolomide、Zeocin および H_2O_2）。						
Diethyl Pyrocarbonate	1609-47-8	162.1	≥ 97% by titration	+4℃	Chloroform or Ethanol	298711-25GM 298711-100GM	17,900 49,000
(DEPC; Diethyl Oxydiformate)	骨格筋におけるリアノジンのリアノジン /Ca^{2+} 受容体チャネルへの結合を用量・時間依存的に阻害し、SR の Ca^{2+} 透過性を上昇させます。未分解ポリヌクレオチドの単離においてヌクレアーゼを特異的に不活化するために有用です。また、血小板活性化因子アセチルヒドロラーゼを阻害します。酵母リボソーム中の 5.8S rRNA の空間配置解析用のプローブとして使用されています。						
DNA Repair Pathway Inhibitor, NS-123	101860-83-7	258.1	≥ 98% by HPLC	+4℃		323115-25MG	34,900
	細胞透過性のニトロ - プロピオフェノン化合物。電離放射線の腫瘍成長阻害作用を選択的に増強し（U251、HT-29 および A549 腫瘍細胞において約 5 μM、U251 異種移植マウスモデルにおいて 50 mg/kg. i.p.）、健常ヒトグリア細胞、Zebrafish 胚およびヌードマウスには明らかな影響を与えません。未修復 2 本鎖 DNA 切断の蓄積を促進し、損傷依存性シグナル伝達を延長させることが知られています。						
Ribonuclease Inhibitor, Human, Recombinant, *E. coli*		49847		-20℃		556881-2500U	28,000
	非共有的な結合によって RNase を不活性化する非競合的阻害剤。cDNA 合成および *in vitro* RNA 合成の改良、ポリソームの収率向上、RNase を含まない抗体の調製などに使用されています。RNase A、B および C を阻害し、コウジカビ属由来の S1 ヌクレアーゼおよび RNase T_1 は阻害しません。						

p53 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Pifithrin-α, *p*-Nitro, Cyclic		299.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (2.5 mg/ml) or Ethanol (250 μg/ml)	506154-5MG	25,000
[2-(4-Nitrophenyl) imidazo[2,1-b]-5,6,7,8-tetrahydrobenzothiazole]	細胞透過性の p53 阻害剤。Pifithrin-α（製品番号 506132）よりも 10 倍高い効力（エトポシドが誘導する皮質ニューロン死からの保護に関する ED_{50} = 30 nM）と 50% 長い半減期（37℃のニューロン培養培地中における $t_{1/2}$ = 6 時間）を示します。しかし、このような *in vitro* での効能にもかかわらず、ラットに *in vivo* 投与した場合には、この阻害剤は有効でありません。*in vivo* では Pifithrin-α, p-Nitro（製品番号 506152）の使用をご検討ください。						
Pifithrin-μ	64984-31-2	181.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	506155-10MG	26,900
(Phenylacetylenylsulfonamide)	細胞透過性の p53 阻害剤。p53 による Bcl-xL と Bcl-2 の両タンパク質への結合を抑え、p53 のトランス活性化能に影響を及ぼすことなく、p53 に依存的なアポトーシスを抑制します。致死量のガンマ線照射からマウス胸腺細胞とマウスを救うことが示されています。スタウロスポリン、デキサメタゾン、Fas または TNF が誘導する細胞死に対しては保護を示さず、カスパーゼ 2、8、9 および 10 の活性には影響しません。						
p53-Snail binding inhibitor, GN25		322.33	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	506170-25MG	29,900
GN25	N-Ras/Myc-MEF あるいは非形質転換の MEF ではなく、K-Ras- 依存的に p53 を活性化し、10 μM 時に 20% の生存力を持つ K-Ras-MEF（K-Ras-形質転換マウス胚 fibroblast）細胞に対して抗増殖効果を示す細胞透過性、水溶性の特異的 p53-Snail 結合阻害剤。K-Ras 突然変異のヒトがん細胞株 A549 において 1-10 μM 時の GN25 治療後、MKN-45（wt-K-Ras/wt-p53）細胞ではなく、Snail ならびに p53 発現が用量依存的に高まります。さらに、p53WT/MT がん細胞において、単一対立遺伝子の突然変異体 p53 の Panc-1 細胞ではなく、p53WT/MT がん細胞の野生型 p53 を選択的に活性することが示されています。異種移植片モデル *in vivo* における抗腫瘍効果を示します。						

Peptidylpropyl cis-trans Isomerase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
PPIase-Parvulin Inhibitor		438.4	≥ 95% by NMR	+4℃	Chloroform (1 mg/ml) or Ethanol (250 μg/ml, cloudy suspension)	529627-10MG	23,000
(Diethyl-1,3,6,8-tetrahydro-1,3,6,8-tetraoxobenzo[lmn][3,8]phenanthroline-2,7-diacetate; PiB)	細胞透過性のナフタレン 4 カルボキシルビスイミド化合物で抗細胞増殖活性を示す（多くのヒトがん細胞株において IC_{50} < 5 μM）。細胞周期停止を引き起こし、強力で選択的な、競合的可逆的な Pin1/Par14 PPIase（peptidyl prolyl cis-trans isomerase）阻害剤（IC_{50} 約 1.5 μM）で、活性部位に結合します。DNA には結合せず、トポイソメラーゼ I は阻害しません。						

細胞周期・細胞分裂

Tautomerase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
MIF Antagonist, ISO-1 [(S,R)-3-(4-Hydroxyphenyl)-4,5-dihydro-5-isoxazole acetic acid, methyl ester; Macrophage Migration Inhibitory Factor Antagonist, ISO-1]	478336-92-4	235.1	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	475837-5MG	22,900
抗炎症性を示す細胞透過性のイソオキサゾリン化合物。触媒活性部位(IC_{50} = 7 μM、ドパクロムトートメラーゼ用)に結合することで MIF トートメラーゼ活性を阻害し、ヒト単球の TNFα、PGE_2 と COX-2 ならびに RAW 264.7 マクロファージにおけるアラキドン酸の生成を抑制します。免疫炎症性の糖尿マウスモデルにおいて抗糖尿病誘発性を示します。							
MIF Antagonist III, 4-IPP 4-Iodo-6-phenylpyrimidine	41270-96-6	282.1	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	475846-10MG	21,000
MIF N-末端プロリンを共有修飾し、ヒト肺腺がん A549 を用いた細胞遊走アッセイ(50% vs 0% 阻害、阻害剤各 10 μM 時)ならびに 足場非依存性の増殖(57% vs 0% 阻害、阻害剤各 10 μM 時)と同様に無細胞ドパクロムトートメラーゼ活性アッセイ(IC_{50} ~5 vs. 50 μM、組換えヒト MIF 使用)において ISO-1(製品番号 475837)よりも高い MIF 阻害有効性を示す細胞透過性ヨードピリミジン化合物。A549 細胞活性 Rac1 集団(50 μM、16 h)*in vitro* を削減し、マウス(1 mg/動物/日または~50 mg/kg/日、腹腔内投与)*in vivo* において肝臓のトートメラーゼ活性を効果的に 50%減らします。							

Telomerase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
PIPER {N,N′-*bis*[2-(1-Piperidino)ethyl]-3,4,9,10-perylenetetracarboxylic Diimide; Telomerase Inhibitor IV}		612.7	≥ 95% by HPLC	-20℃	5% Acetic acid (50 mg/ml)	528120-10MG	24,900
DNA の GGGG 配列に結合してヒトテロメラーゼを強力に阻害するペリレン骨格を有するリガンド。PIPER と最も強く結合する座位は GGGG- の 3' 結合部と思われます。核酸と非特異的に結合する場合もあります。細胞増殖阻害剤としても有用であると思われます。							
Telomerase Inhibitor III, Sodium Salt [5′-d(TTAGGG)-3′; TAG-6]		~ 1900		-70℃	H_2O	581004-150NMOL	20,000
短い六量体のフォスフォロチオネート・オリゴヌクレオチド(PS-ODN)のテロメア擬配列。細胞ライセートにおけるテロメラーゼ活性を阻害し、2.5 μM 未満の濃度で *in vitro* および *in vivo* における細胞分裂時間を延ばします。							
Telomerase Inhibitor IX [N,N′-bis(2,3-Dihydroxybenzoyl)-1,3-phenylenediamine; MST-312]	368449-04-1	380.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	581011-10MG	28,000
細胞透過性のビスカテコール含 m-フェニレンジアミン化合物で細胞増殖阻害活性を有します。テロメラーゼの強力で可逆的な阻害剤(U937 細胞の TRAP ライセートに対し IC_{50} = 670 nM)。MST-312 の長時間処理により U397 細胞でテロメアの短縮と生育停止がみられます。Taq DNA polymerase の活性は阻害しません(IC_{50} > 3 μM)。							
TMPyP4 [*meso*-5,10,15,20-Tetrakis-(N-methyl-4-pyridyl)porphine, Tetratosylate]	36951-72-1	1363.6	≥ 90% by TLC	+4℃	H_2O (1 mg/ml)	613560-25MG	21,900
ヒト・テロメラーゼの強力な阻害剤(IC_{50} = 6.5 μM)。TMPyP4 はテロメア 4 重鎖のコア部分で G カルテットにスタッキングすることにより、テロメア 4 重鎖に強く結合して、テロメラーゼの阻害をもたらします。DNA 四重構造の存在下で強烈に蛍光を発します。							

Topoisomerase 関連 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Acetyl-11-keto-β-Boswellic Acid, *Boswellia serrata*	67416-61-9	512.7	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	110123-5MG	47,000
(3-O-Acetyl-11-keto-β-Boswellic Acid; AKβBA)	抗癌、抗炎症を示すウルサンタイプの細胞透過性の 5 環性トリテルペン。IκBα のリン酸化と劣化を防ぎ、化学療法抵抗性のアンドロゲン非依存の PC-3 前立腺がん細胞（~10 μM）の NF-κB 介在遺伝子転写を阻害することを示します。細胞内 Ca^{2+} を動かし、p42/44 と p38 MAPKs（~30 μM、ヒト PMN）の活性を刺激し、活性酸素主の形成を向上させます。また、アポトーシスを誘発し、5 リポキシゲナーゼ（IC_{50} = 1.5 μM、ラット PMNL）ならびにトポイソメラーゼ I（≥ 10 μM、仔ウシ胸腺）の非レドックス、非競合阻害剤として働きます。輸送を促進するために γ- シクロデキストリンと錯体を形成するとき、AkβBA は腫瘍増殖ならびに阻害について *in vivo* 有効性を示すことが明示されています。						
Camptothecin, *Camptotheca acuminata*	2114454	348.4	≥ 95% by TLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) and MeOH (40 mg/ml). Stock solutions made with methanol will remain cloudy.	208925-50MG	9,900
[4-Ethyl-4-hydroxy-1H-pyrano[3′,4′:6,7] indolizino[1,2-b]quinoline-3,14(4H,12H) dione]	DNA トポイソメラーゼ I 阻害剤。抗白血病作用および抗腫瘍作用を示します。HL-60 細胞およびマウス胸腺細胞においてアポトーシスを誘導します。細胞周期を G_2/M 期で停止させます。						
Daunorubicin, Hydrochloride	23541-50-6	564	Potency: ≥ 840 μg/mg	room temp.	Aqueous buffers, H_2O, or Methanol	251800-5MG	16,900
(Daunomycin, HCl)	強力な抗がん剤。標的部位は、ミトコンドリアのチトクローム c オキシダーゼであると推定されています。RNA および DNA の合成を阻害することが示されています。真核生物のトポイソメラーゼ I および II を阻害します。DNA 一本鎖切断を誘導します。また、HeLa S3 腫瘍細胞においてアポトーシスを誘導します。						
Doxorubicin, Hydrochloride	25316-40-9	580	≥ 95% by HPLC	room temp.	H_2O (10 mg/ml)	324380-10MG	25,000
(Adriamycin; 14-Hydroxydaunomycin, HCl)	抗腫瘍性抗生物質。トポイソメラーゼ II を阻害する（IC_{50} = 100 nM）、活性の高いミオトキシンです。おそらく DNA 二重らせんへの特異的インターカレーションによって核酸に結合し、核酸の合成を阻害します。横紋筋肉腫細胞株においてアポトーシスを誘導します。						
Ellipticine	519-23-3	246.3	≥ 99% by TLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Ethanol (1 mg/ml)	324688-10MG	18,900
(5,11-Dimethyl-6H-pyrido[4,3-b]carbazole)	抗腫瘍性アルカロイド。トポイソメラーゼ II の阻害剤として作用し、トポイソメラーゼ II を介した DNA 切断を促進するインターカレート剤としても作用します。また、ミトコンドリアの酸化的リン酸化の脱共役能を有します。						
Epirubicin Hydrochloride	56390-09-1	580	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O (1 mg/ml)	324905-5MG	30,000
(4′-Epidoxorubicin, HCl)	抗腫瘍性抗生物質。Doxorubicin（製品番号 324380）の立体異性体であり、ドキソルビシンより低い心毒性を示します。本品の抗腫瘍作用は、トポイソメラーゼ II のターゲティングを介したものです。						
Etoposide	33419-42-0	588.6	> 97% by HPLC	room temp.	DMSO (25 mg/ml)	341205-25MG	9,000
(VP-16)	ポドフィロトキシン誘導体。トポイソメラーゼ II 阻害剤として作用します（IC_{50} = 59.2 μM）。生殖細胞腫瘍、小細胞肺がん、悪性リンパ腫などの様々な腫瘍に対して強力な活性を示します。マウス胸腺細胞および HL-60 ヒト白血病細胞においてアポトーシスを誘導します。						
Camptothecin, 10-Hydroxy-, *Camptotheca acuminata*	64439-81-2	364.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	390238-25MG	25,000
(HCPT; 10-Hydroxycamptothecin)	強力な DNA トポイソメラーゼ I 阻害剤。*in vitro* でマウス肝がん細胞における DNA 合成を抑制します。ヒストン H1 および H3 のリン酸化に対して選択的な阻害作用を示しますが、他のヒストンに対する作用はそれより微弱です。						
Merbarone	97534-21-9	263.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	445800-25MG	22,000
[NSC-336628; 5-(N-Phenylcarboxamido) -2-thiobarbituric Acid]	DNA を障害したり、DNA トポイソメラーゼ II (topo II) 開裂複合体を安定化することなく、DNA topo II の触媒活性を阻害する抗がん薬です（精製哺乳類 topo II に対して IC_{50} = 20 μM、topo I に対して IC_{50} = 約 200 μM）。また、カスパーゼ -3 様プロテアーゼ依存性機構によって、ヒト白血病 CEM 細胞のアポトーシスを誘導します。						
Topoisomerase IIα Inhibitor, TSC24		258.34	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (15 mg/ml)	614852-10MG	24,000
(E)-N,N-dimethyl-2-(quinolin-2-ylmethylene) hydrazinecarbothioamide	選択的に ATP 競合的なトポイソメラーゼ IIα 阻害剤ならびに Fe キレート剤として働く細胞透過性の TSC（チオセミカルバゾン）誘導体。Fe キレート能力とは無関係に、この化合物は Topo IIα（K_d = 18 μM）の ATPase ドメインの結合で、ATP と競合することで Topo IIα- 酸触媒の ATP 加水分解をブロッキングすることが示されています。また、ノコダゾール処理の HT-29 細胞における 1 μM 時の M 期細胞周期停止を示しています。この化合物は、HeLa、HL-60、SGC7901、HT-29 培養（IC_{50} = それぞれ 90 nM、50 nM、30 nM、20 nM）そしてナノモル範囲で IC_{50} の腫瘍細胞株のより広いパネルに対して際立った、または明確な選択性のない抗増殖性の活性を示します。						

細胞接着阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
H-Arg-Gly-Asp-Ser-OH	91037-65-9	433.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	03-34-0002-25MG	28,000
(Fibronectin Inhibitor; RGDS)	血小板結合部位への結合によってフィブロネクチンの機能を阻害することが示されています。						
H-Gly-Arg-Gly-Asp-Ser-OH	96426-21-0	490.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	5% Acetic Acid (1 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	03-34-0027-25MG	62,000
(GRGDS)	細胞結合タンパク質ドメイン。線維芽細胞のフィブロネクチンへの直接結合を競合的に阻害します。マウスにおいて、膀胱腫瘍細胞移植を妨げることが示されています。						
H-Gly-Arg-Gly-Asp-Ser-Pro-OH		587.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	5% Acetic acid (1 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	03-34-0035-5MG 03-34-0035-25MG	14,000 48,500
(GRGDSP)	フィブロネクチンの血小板結合部位への結合を阻害することが示されています。						
H-Gly-Arg-Ala-Asp-Ser-Pro-OH		601.6	≥ 98% by HPLC	-20℃	5% Acetic acid (1 mg/ml)	03-34-0052-5MG 03-34-0052-25MG	12,000 48,500
(GRADSP)	他のフィブロネクチン阻害剤に対する、不活性型のコントロールペプチドです。						

細胞周期・細胞分裂

細胞接着阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Cyclo(Arg-Gly-Asp-D-Phe-Val) (RGDfV Peptide, Cyclic)	137813-35-5	574.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	1 N Acetic acid (5 mg/ml)	182015-1MG	43,900
	細胞接着の強力な阻害剤。ラミニンおよびビトロネクチン基質への腫瘍細胞の接着を阻害します。ラットを使用した *in vivo* 試験によって、ラットにおける虚血性急性腎不全の改善に有用であることが示されています。また、細胞間接着を阻害することによって、尿細管閉塞を抑制します。						
BAY 11-7082 {(E)3-[(4-Methylphenyl)sulfonyl]-2-propenenitrile}	19542-67-7	207.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (200 mg/ml)	196870-10MG	19,900
	潜在的抗炎症剤。IκB-α の TNF-α 誘導性リン酸化を選択的かつ不可逆的に阻害し（IC_{50} = 10 μM）、NF-κB および接着分子の発現を減少させます。構成的 IκB-α の自己リン酸化には影響を及ぼしません。内皮細胞・白血球接着分子 E- セクレチン、VCAM-1、および ICAM-1 の TNF-α 誘導性細胞表面発現を阻害します。						
BAY 11-7085 {(E)3-[(4-*t*-Butylphenyl)sulfonyl]-2-propenenitrile}	196309-76-9	249.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	196872-10MG	25,900
	BAY 11-7082（製品番号 196870）に極めて近い生物学的特性を有します。また、BAY 11-7085 は強力な *in vivo* 抗炎症作用を示します。						
Cell Sheet Migration Inhibitor, Locostatin {(4S)-3-[(E)-But-2-enoyl]-4-benzyl-2-oxazolidinone; Locostatin; UIC-1005}	133812-16-5	245.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Methanol (50 mg/ml)	219469-10MG	34,000
	細胞透過性の（クロトニル）オキサゾリジノン化合物で、強力な可逆性の細胞走化性と増殖の阻害剤（IC_{50} = 14 μM で MDCK cell 単層培養の創傷閉鎖を阻害）。創傷の縁での葉層伸長を妨げ、またカエル胚移植において胚の初期発生を阻害します。抗菌活性は示しません。運動性に関連したシグナル伝達の有用なツールです。						
Pentoxifylline [3,7-Dihydro-3,7-dimethyl-1-(5-oxohexyl)-1H-purine-2,6-dione; PTX]	1677687	278.3	≥ 99% by titration	room temp.	H_2O (50 mg/ml)	516354-500MG	8,000
	非選択的ホスホジエステラーゼ阻害物質。エンドトキシンの誘導による腫瘍壊死因子 -α（TNF-α）の合成を阻害します。PTX は β_1 および β_2 インテグリンリガンドである VCAM-1 および ICAM-1 への T 細胞の接着を阻害します。またリポ多糖によって起こるミクロソーム P450 のダウンレギュレーションも阻害します。						

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
14-3-3 Antagonist I, 2-5		506.4	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO	100081-5MG	58,900
14-3-3 Antagonist II,BV02		395.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO	100082-10MG	30,900
CBP-CREB Interaction Inhibitor	92-78-4	297.7	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	217505-250MG	12,900
Integrin αvβ3 Antagonist, P11			≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O	407272-5MG	18,900
Pre-mRNA Splicing Inhibitor, Isoginkgetin	548-19-6	566.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO	416154-10MG	29,900
c-Myc Inhibitor [10058-F4; (*Z*,*E*)-5-(4-Ethylbenzylidine)-2-thioxothiazolidin-4-one]		249.4	≥ 95% by HPLC (sum of two isomers)	+4℃	DMSO (200 mg/ml)	475956-10MG	18,000
	特異的に c-Myc-Max 相互作用を阻害し、それによって c-Myc 標的遺伝子発現の活性化を妨げる細胞膜透過性チアゾリジノン化合物。*in vitro* および *in vivo* の両方で c-Myc 依存的に、腫瘍細胞増殖を阻害することが示されています（c-Myc をトランスフェクトした Rat1α 繊維芽細胞において 64 μM）。						
c-Myc Inhibitor II 7-Nitro-N-(2-phenylphenyl)-2,1,3-benzoxadiazol-4-amine	413611-93-5	332.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	475957-10MG	17,900
	HLH-、ZIP-、HLH-ZIP を含むタンパク質の 31 種類のペアに対する c-Myc-Max や Mad1-Max、Myf5-HEB の相互作用の破壊を選択的に示す細胞透過性のベンゾキサジアゾール化合物。10058-F4（製品番号 475956）と同様に、10074-G5 はマウス線維芽細胞細胞株 TGR1 の c-Myc 依存性増殖を選択的に阻害し、c-Myc 依存性転写活性を効果的に抑制することを示しています。様々な突然変異の、切断型 c-Myc 構築物を使った結合試験は、10074-G5 が aa residues 363 と 381（K_D = 4.4 μM）との間の c-Myc ヘリックス 1 型領域を標的にする一方、10058-F4 相互作用部位は 412（K_D = 13 μM）を通じて aa residues 402 内に位置していることを明らかにしました。						
c-Myc Inhibitor III, Mycro2		408.4	≥ 99% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	475965-10MG	28,900
ProteinLysMethyltransferaseInhibitor, UNC		515.69	> 95% by HPLC	-20℃	DMSO	476496-5MG	36,000
RORγ Inverse Agonist, SR2211			≥ 99% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	557353-5MG	28,900

細胞増殖・遊走阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Dvl-PDZ Domain Inhibitor, Peptide Pen-N3		3512.2	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	322337-2MG	16,900
	Dvl (dishevelled) ファミリータンパク質の 22 アミノ酸からなる PDZ ドメインに結合するカルボキシアミドの N 末端に、16 アミノ酸からなるアンテナペディアホメオドメイン (antennapedia homeodomain) 由来の細胞透過性アセトアミドを融合させ、細胞を用いた研究に利用しやすくしたものです。HEK293 培養において Wnt3a 刺激時 (IC_{50} = 11 μM) または Dvl1/2/3 過剰発現時の細胞における β カテニン蓄積および転写活性の上方制御を選択的に阻害するものの、APC 変異 HCT-15 大腸癌細胞における Wnt3a- もしくは Dvl1/2/3- 非依存性の構成的活性化型 Wnt 経路によるシグナル伝達は阻害しないことが判明しています。Box5 と異なり、Pen-N3 中の PDZ と相互作用する配列は元来ランダムファージディスプレイ法によるスクリーニングにより同定されたもので、Wnt その他の既知の細胞タンパク質に由来するものではありません。						
Aromatase Inhibitor I		321.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml)	182540-1MG	19,000
[4-(Imidazolylmethyl)-1-nitro-9H-9-xanthenone]	アロマターゼ(P450arom; IC_{50} = 40 nM、ヒトアロマターゼ用)の有効な競合的、非ステロイド系阻害剤。アロマターゼ活性を阻害するのにファドロゾールよりも高い有効性が報告されています。17α- ヒドロキシラーゼを著しく阻害しません。						
CBFβ Inhibitor		234.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml) or Ethanol (20 mg/ml)	219505-10MG	22,900
	細胞透過性のチアゾリル化合物。CBFβ (コア結合因子 β) に結合し、CBFβ - Runx1 (コア結合因子 α) 相互作用をアロステリックに破壊します (IC_{50}= 約 3.5 μM)。ヒト白血病 ME-1 細胞において選択的に増殖抑制作用を示し (IC_{50}= 約 100 μM)、毒性はほとんどありません。						
CCR2 Antagonist	445479-97-0	593.7	≥ 97% by HPLC (racemic mixture)	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or H_2O (5 mg/ml)	227016-5MG	35,900
	細胞透過性の cis- ジアミドシクロヘキシル尿素化合物で、高親和性結合 CCR2 アンタゴニストとして作用し (末梢血単核球中における MCP-1 置換法で測定した wt-CCR2、E291A-CCR2 および T292A-CCR2 に対する IC_{50} はそれぞれ 7.5、3.7 および 303.7 nM)、CCR3 (濃度 10 μM において 37% 阻害) よりもはるかに高い選択性を示します。さらに、カルシウムフラックスおよび走化性を強力に阻害します (IC_{50} はそれぞれ 18 nM および 1 nM)。						
Combretastatin A-4	117048-59-6	316.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	234200-10MG	24,000
	Combretum caffrum 由来の細胞透過性スチルベノイドフェノールの化学合成品。colchicine (製品番号 234115) のチューブリン結合と競合し (等モル濃度における阻害率 96.4%；K_i = 1.1 μM)、チューブリンの重合 (IC_{50} = 2-3 μM) および細胞の微小管の集合を妨害します。有糸分裂および *in vitro* 腫瘍増殖の阻害活性 (L1210 培養における IC_{50} = 7 nM) に加え、CA4 は血管新生阻害剤としても作用し、内皮細胞骨格を標的とすることにより *in vivo* における腫瘍細胞の壊死を効果的に誘導します。						
Soluble Epoxide Hydrolase Inhibitor, NCND		310.5	≥ 95% by TLC	+4℃	CH_2Cl_2 (1 mg/ml)	324813-25MG	22,000
(CDU; 1-Cyclohexyl-3'-dodecylurea; N-Cyclohexyl-N'-dodecylurea)	細胞透過性の 1,3 - 置換尿素化合物で、抗高血圧、抗炎症作用を有します。強力で選択的な、競合的、強結合性、遷移状態アナログ soluble epoxide hydrolase 阻害剤 (sEH; IC_{50} = 9.8 nM for mouse recombinant sEH, 85.2 nM for human recombinant sEH)。ヒト VSMC (vascular smooth muscle cell) 細胞の増殖を抑制します。						
Hec1/Nek2 Mitotic Pathway Inhibitor I, INH1	313553-47-8	308.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml) or Ethanol (50 mg/ml)	373270-10MG	23,700
N-(4-(2,4-Dimethylphenyl)-thiazol-2-yl)-benzamide	細胞透過性のチアゾリルベンズアミド化合物。Hec1 を優先的に標的とし、Hec1/Nek2 複合体を破壊して Nek2 の安定性を低下させることにより、動原体に局在化する Hec1 の量を減少させます。一時的な有糸分裂停止を誘導し、数種の乳癌細胞の増殖を阻害 (GI_{50}=10 ～ 21 μM) することが判明しています。さらに、異種移植マウスモデルにおける腫瘍増殖を低下させます (50 mg/kg、腹腔内投与)。						
Hec1/Nek2 Mitotic Pathway Inhibitor II, INH6	1001753-24-7	322.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	373271-10MG	18,000
N-(4-(2,4,6-Trimethylphenyl)-thiazol-2-yl)-benzamide	細胞透過性の INH1 (製品番号 373270) アナログ。アリール環がジメチル化ではなくトリメチル化を受けており、MB231、MB468、HeLa、および K562 細胞に対する増殖抑制活性 (IC_{50} はそれぞれ 1.7、2.1、2.4、および 2.5 μM) が INH1 (IC_{50} はそれぞれ 8.6、10.5、8.8、および 11.7 μM) より有意に阻害します。プルダウンアッセイでは HeLa 細胞抽出物中から Hec1 を選択的に沈降しますが、Nek2 は沈降しないことが判明しています。HeLa 培養を処理すると、細胞 Nek2 (6.25 μM , >4 時間) および Hec1 のダウンレギュレーション (6.25 μM , >16 時間)、アポトーシス誘起 G1 集団の増加 (10 倍；2.5 μM、72 時間)、さらに多極紡錘体の形成や中期染色体の誤整列などの有糸分裂異常が生じます。						
IL-1R Antagonist		302.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol	407616-10MG 407616-25MG	19,900 37,000
(BB-loop Mimic; Hydrocinnamoyl-L-valyl Pyrrolidine; TIR Domain Mimic)	細胞透過性の末端保護 L- バリル誘導体。IL-1RI 受容体 (I 型 IL-1 受容体) の TIR (Toll/IL-1R/resistance) ドメイン BB ループの MyD88 結合配列をベースにした化合物です。TIR ドメインを介した MyD88/IL-1RI 相互作用を特異的に阻害し、TLR4/MyD88 相互作用には影響を与えません。*in vivo* マウスにおいて IL-1β 誘発発熱を抑制することが明らかになっています。また、マウスリンパ球および *in vitro* EL4 胸腺腫細胞において、MAP キナーゼシグナル伝達カスケードの IL-1β による活性化を抑制します。LPS による活性化は抑制しません。						
IL-2Rα Antagonist		560.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (28 mg/ml) or Ethanol (2 mg/ml)	407621-5MG	40,000
[(R)-N-(2-(1-(Aminoiminomethyl)-3-piperidinyl)-1-oxoethyl)-4-(phenylethynyl)-L-phenylalanine methyl ester, trifluoroacetate; Ro26-4550]	非ペプチジル - アシルフェニルアラニン化合物。IL-2 に結合し、IL-2/IL-2Rα 相互作用を競合的に阻害します (IC_{50} =3 μM)。						
Membrane Traffic Inhibitor, A5		308.9	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	444805-10MG	32,900
1-(4-(4-(E-2-Methyl-2-butenyl) piperazinyl) phenyl) ethanone	細胞透過性のピペラジニル化合物。アダプタータンパク質 -1 複合体 (AP-1) 局在を変化させ、HeLa 細胞や酵母 MDY326、MDY334 細胞において 50 μM で AP-1 媒介トランスゴルジ網 (TGN) およびエンドソームトラフィックの特異的ブロッカーとして作用します。						
NBI-31772	374620-70-9	341.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	479830-5MG	28,900
{[1-(3',4'-Dihydroxybenzoyl)-6,7-dihydroxyisoquinoline-3-carboxylic Acid]}	6 種類のヒトインスリン様成長因子 -I 結合タンパク質 (IGFBP) すべてに対して高い親和性を示す非ペプチドリガンド (K_i = 約 1 - 17 nM)。3T3 線維芽細胞において IGF-I:IGFBP 複合体からインスリン様成長因子 -I (IGF-I) を解離させますが、IGF 受容体とは相互作用しません。						
Ras-Net (Elk-3) Pathway Inhibitor, XRP44X	729605-21-4	380.9	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mM) or Ethanol (50 mM)	480150-5MG	15,900
1-(3-Chlorophenyl)-4-((3-methyl-1-phenyl-1H-pyrazol-5-yl) carbonyl) piperazine	細胞透過性のピラゾール化合物。無細胞アッセイにおいて Colchicine (製品番号 234115) 結合部位 (K_d= 0.3 mM) を標的として *in vitro* チューブリン重合を阻止するとともに (IC_{50} = 0.2 μM)、微小管およびアクチン細胞骨格構造の両方を攪乱することにより HUVEC 培養細胞におけるプレブ形成を誘導します。アクチンおよびチューブリンフィラメントに対する作用とは別に、FGF-2 (製品番号 341595) 刺激時に Ras およびその下流に位置する Raf、MEK、Erk、Rsk、および Net (Elk-3/SAP-2/Erp) などのエフェクター分子の活性化を阻止すると報告されています。抗増殖アッセイにおいて HUVEC, NIH3T3、およびその他 9 種類の腫瘍細胞株の増殖を強力に阻害します (IC_{50} ≤ 11.3 nM)。						

細胞増殖・遊走阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Ras/Rac Transformation Blocker, SCH 51344	171927-40-5	316.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (20 mg/ml)	553509-10MG	33,900
[6-Methoxy-4-(2-((2-hydroxyethoxyl)-ethyl) amino)-3-methyl-1H-pyrazolo[3,4-b]quinoline]	細胞透過性のピラゾロキノリン化合物。Ras が誘導する悪性形質転換の効果的な阻害剤として作用し、Ras/Rac に依存的なアクチン - ミオシン II 複合体からの EMS1 の解離ならびに膜ラフリングを阻害します。SCH 51344 の効果は ERK と JNK が関与するもの以外の Ras/Rac 経路に限られています。						
SMC Proliferation Inhibitor-2w		419.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	573117-5MG	24,000
[N-(3',4',5',-Trimethoxybenzoyl)-(3,4-dimethoxy) ethylanthranilate]	内皮細胞 (IC_{50} = 4.6 μM) に比べ、15 倍高い選択性をヒト冠状動脈平滑筋細胞 (IC_{50} = 310 nM) の増殖阻害に対して示すジアリルアミド類似体。Tranilast (製品番号 616400) よりも 80 倍高い効力を示します。						
TAS-301		357.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or ethanol	608050-10MG 608050-25MG	26,000 56,000
[3-bis(4-Methoxyphenyl) methylene-2-indolinone]	細胞透過性のインドリノン化合物で、細胞増殖阻害活性を持ちます。成長因子に誘導される血管平滑筋細胞 VSMCs (vascular smooth muscle cells) 移動と増殖を強力に阻害します。作用は、電位非依存性 Ca^{2+} 流入をブロックし、下流のシグナル、Ca^{2+}/PKC シグナル伝達経路などを遮断して、AP-1 誘導による細胞骨格脱重合阻害をすることで発揮されます。ラット頚動脈やブタ冠動脈において balloon injury における新生内膜形成を阻止します。						
Vacuolin-1		577.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml)	673000-10MG	25,900
	細胞透過性のトリアジン系化合物。リソソームと細胞膜との Ca^{2+} 依存性融合ならびにリソソーム内容物の放出を阻害し、enlargeosome および他の膜結合型オルガネラには影響を与えません。本品は、アクチンまたはチューブリンの細胞骨格ネットワークの形成を阻害しません。また、ER から細胞膜への構成性経路に沿ったメンブレントラフィックも阻害しません。						

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
MetAP2 Inhibitor, A832234		460.56	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO	654271-2MG	29,000

ATM キナーゼ阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
ATM Kinase Inhibitor (2-Morpholin-4-yl-6-thianthren-1-yl-pyran-4-one)	587871-26-9	395.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (4 mg/ml)	118500-2MG	25,900
細胞透過性の 2 置換ピラノン化合物。ATM キナーゼの強力な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50}=13 nM；K_i=2.2 nM）。他の PIKK ファミリーキナーゼに対しては優れた選択性を示し（DNA PK、mTOR、PI 3K に対する IC_{50} はそれぞれ、2.5、9.3、16.6 μM；PI 4K および ATR に対する IC_{50} は 100 μM 以上）、他の 60 種類のキナーゼパネルに対しては 10 μM の高濃度であってもほとんど活性を示しません。電離放射線（IR）照射後における ATM 依存的な細胞タンパク質のリン酸化を阻害し、野生型 ATM をもつ細胞を IR および DNA 傷害物質の細胞毒性に対して感受性にします。ただし、変異型 ATM をもつ細胞には影響を与えません。						
ATM/ATR Kinase Inhibitor (CGK 733)	905973-89-9	555.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	118501-5MG	46,900
細胞透過性のチオ尿素化合物。ATM および ATR のキナーゼ活性を選択的に阻害し（IC_{50}= 約 200 nM）、他の PIKK ファミリーメンバー（PI3K、mTOR および DNA PK）や p53 をリン酸化することが知られているキナーゼ（ERK、CK1、Cdk2、JNK、PKC、CAK、Chk1、PKR および p38）に対しては有意な影響を与えません。ヒト初代培養 BJ および HMEC 細胞において老化を逆行させることが示されています。LY 294002（製品番号 440202 および 440204）とは異なり、この阻害剤は細胞の PI3K-PDK1 Akt シグナル伝達経路には干渉しません。						
InSolution™ ATM Kinase Inhibitor		395.5	≥ 95% by HPLC	-20℃		118502-2MG	26,900
MRN-ATM Pathway Inhibitor, Mirin	299953-00-7	220.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	475954-10MG	23,000

DNA-Dependent Protein Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Compound 401	168425-64-7	281.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	234501-5MG	39,900
細胞透過性のピリミド - イソキノリノン化合物。DNA-PK の強力な可逆的かつ ATP 競合的な阻害剤として作用し（IC_{50} = 280 nM）、mTOR（IC_{50} = 5.3 μM）に対するより約 19 倍高い選択性を示します。PI 3-K、ATM および ATR を含む他の 43 種類の一般的なキナーゼに対する作用ははるかに弱いか全くありません。$TSC^{1-/-}$ マウス胚線維芽細胞においてアポトーシスを誘導して mTOR 依存性増殖を阻害することが知られています。						
DNA-PK Inhibitor (4,5-Dimethoxy-2-nitrobenzaldehyde; DMNB; DNA-Dependent Protein Kinase Inhibitor)	20357-25-9	211.2	≥ 90% by GC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	260960-10MG	19,900
DNA-PK（DNA 依存性プロテインキナーゼ）活性の強力かつ選択的な阻害剤として働く細胞透過性のバニリン誘導体（IC_{50} = 15 μM）。NHEJ（非相同的 DNA 末端連結）による DNA-PK 媒介性 DSB（二本鎖切断）DNA 修復を阻害します。Cisplatin（製品番号 232120）による死滅に対して、細胞を効果的に感作することが示されています。PKC または Chk2 キナーゼの活性には影響を与えません。							
DNA-PK Inhibitor II [DNA-Dependent Protein Kinase Inhibitor II; LY293646; 2-(Morpholin-4-yl)-benzo[h]chromen-4-one; NU7026]	154447-35-5	281.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (2 mg/ml) or Methanol (700 μg/ml)	260961-5MG	38,900
細胞透過性のベンゾクロメノン化合物で、強力で選択的な DNA-PK の ATP 競合阻害剤です（IC_{50} =0.23 μM）。他の PI3K- 関連キナーゼ（PI3K に対して IC_{50}=13μM、ATM と ATR に対して＞ 100μM）に比べ、DNA-PK に対して高選択性で、PARP-1 には影響を与えません。イオン放射 IR（ionizing radiation）による DNA ダメージの、DNA-PK を介する細胞内 DNA DSB（double strand break）修復および PLDR（potentially lethal damage recovery）修復を阻害しますが、PARP-1 を介する修復は阻害しません。増殖細胞、静止期細胞ともに IR に対する感受性を高めます。							
DNA-PK Inhibitor III [1-(2-Hydroxy-4-morpholin-4-yl-phenyl) ethanone; IC86621]	404009-40-1	221.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	260962-1MG	23,900
細胞透過性のアリル - モルフォリノ化合物。DNA-PK（IC_{50} = 0.12 μM）および PI3 キナーゼ触媒サブユニット p110β（IC_{50} = 0.135 μM）に対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します。DNA-PK を介した細胞内 DNA DSB（二本鎖切断）の修復を阻害し（EC_{50} = 68 μM）、*in vitro* と *in vivo* の双方において DSB 誘導性の抗腫瘍活性を増強しますが、DSB の非存在下では 50 μM までの濃度で細胞毒性作用を示しません。極めて高濃度でのみ PI3K p110α（IC_{50} = 1.4 μM）、p110γ（IC_{50} = 0.88 μM）、および p110δ（IC_{50} = 1.0 μM）を阻害します。Cdk2、Src、PKA、PKC、Chk1、CK1、ATM、および FKBP12 を含む他の各種キナーゼのパネルに対しては、100 μM の高濃度でも作用を示しません。							
DNA-PK Inhibitor V [AMA37; ArylMorpholine Analog 37; 1-(2-Hydroxy-4-morpholin-4-yl-phenyl)-phenyl-methanone]	404009-46-7	283.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	260964-1MG 260964-5MG	25,900 79,000
モルフォリノ - ベンゾフェノン化合物。DNA-PK に対する強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50} = 0.27 μM）。高濃度では、PI3 キナーゼ触媒サブユニット p110 アイソザイムを阻害します [IC_{50} = 32 μM（α）、3.7 μM（β）、22 μM（δ）、約 100 μM（γ）]。ATM、ATR、CK2、GRK2、mTOR、PI3KC2α、PI3KC2β、PI3KC2γ、および PI4Kβ を含む他の各種キナーゼのパネルに対しては、50 μM の高濃度でもほとんど阻害作用を示しません。							

MDM2 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
MDM2 Antagonist, Nutlin-3, Racemic	548472-68-0	581.5	≥ 98% by NMR	-20℃	DMSO (25 mg/ml) or Ethanol (25 mg/ml)	444143-1MG	23,900
細胞透過性のシス - イミダゾリン化合物。強力かつ選択的な MDM2 拮抗剤 [IC_{50} = 90 nM（Nutlin-3a）、13.6 μM（Nutlin-3b）] として作用し、抗腫瘍作用を示します。p53 結合ポケット内で MDM2 に結合することによって p53 経路を活性化し、MDM2-p53 相互作用を阻害します。本品は、野生型 p53 をもつ各種がん細胞および異種移植腫瘍マウスにおいて、アポトーシスの誘導によって腫瘍増殖を抑制することが明らかになっています。							
MDM2 Antagonist II, NSC 66811 [7-(Anilino(phenyl)-methyl)-2-methyl-8-quinolinol]		340.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	444144-10MG	36,900
細胞透過性の非ペプチジル - キノリノール化合物。MDM2 の p53 結合ポケットに高い親和性で結合し（K_i = 約 120 nM）、MDM2-p53 相互作用を阻害して p53 機能を活性化します。P53 野生型 HCT116 において p53、MDM2 および p21 の細胞内レベルを誘導することが示されています。							
MDM2 Inhibitor (*trans*-4-Iodo, 4'-boranyl-chalcone)	562823-84-1	378	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	444145-10MG	25,900
細胞透過性のボラニル - カルコンで、Mdm2 に強く結合し、MDM2/p53 複合体を非可逆的に破壊します。MDM2 に選択的な毒で、過剰発現させた乳がん細胞株に対し毒性を示します（MDA-MB-435, MDA-MB-231, Wt-MCF7 に対しそれぞれ IC_{50} = 10, 8.8, 7 μM ）（正常の MCF-10A 、MCF-12A にはそれぞれ IC_{50} = 75 and 63 μM ）。							
InSolution™ Nutlin-3, Racemic		581.5		-20℃	10 mM (1 mg/172 μl) DMSO	444151-1MG	21,900
抗腫瘍作用を示す細胞透過性の強力かつ選択的な MDM2 アンタゴニストです（Nutlin-3a に対する IC_{50} = 90 nM、Nutlin-3b に対する IC_{50} = 13.6 μM）。p53 結合ポケット内の MDM2 に結合して MDM2-p53 相互作用を阻害することによって p53 経路を活性化します。野生型 p53 とともにいくつかのがん細胞株および異種移植腫瘍マウスにおいてアポトーシスを誘導することが知られています。							

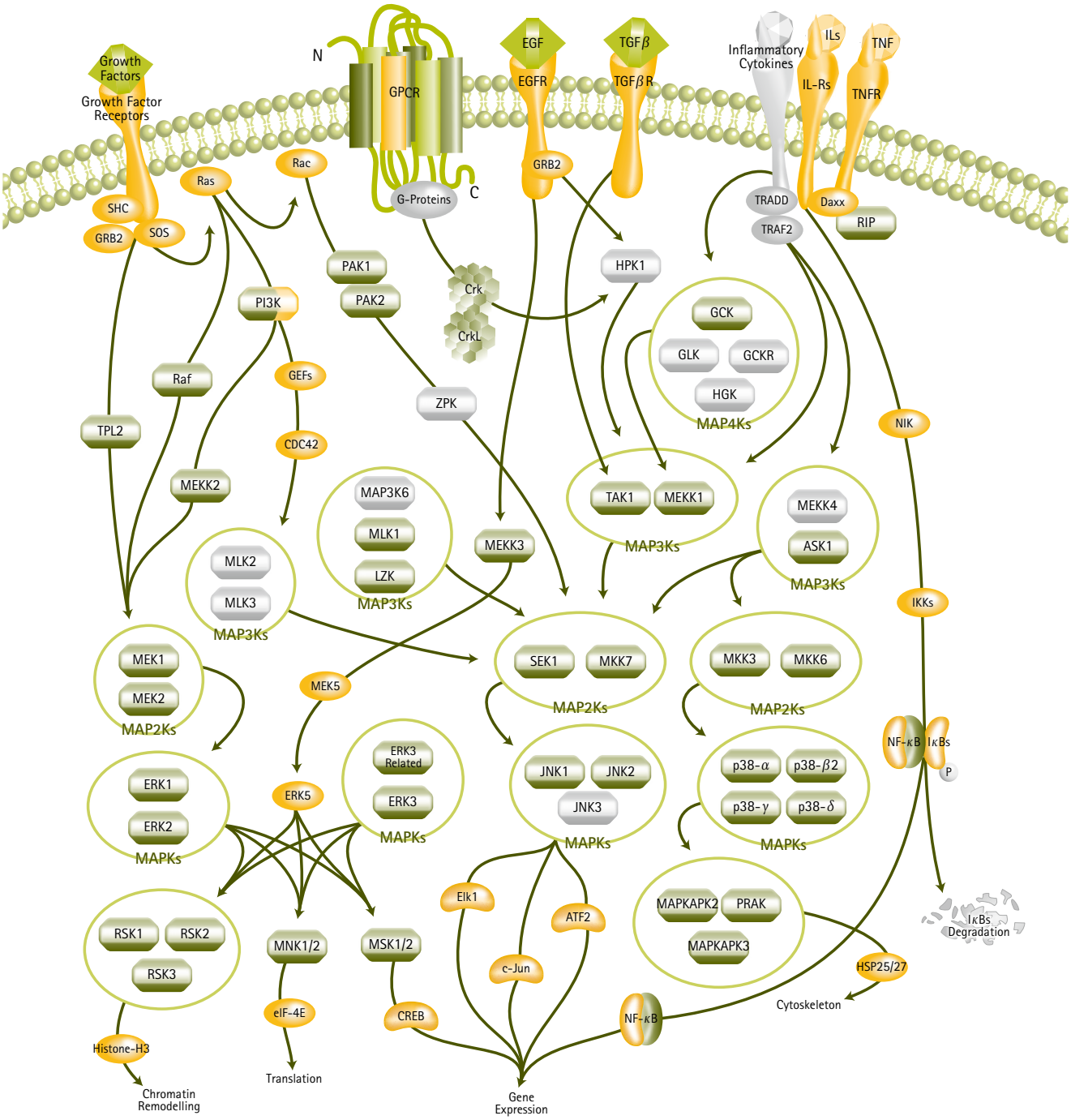
糖タンパク質関連阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
N-(n-Butyl)deoxygalactonojirimycin		219.3	≥ 97% by TLC	-20℃	Methanol (5 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	203994-5MG	41,900
	強力かつ選択的な α-D- ガラクトシダーゼ阻害剤。						
N-Butyldeoxynojirimycin, Hydrochloride	72599-27-0	255.7	≥ 95% by TLC	+4℃	H_2O (1 mg/ml)	203996-10MG	53,900
(N-Butyl-DNJ, HCl; NB-DNJ, HCl)	アルキル化イミノ糖、非ホルモン性。セラミド特異的グリコシル転移酵素および ER α- グリコシダーゼ I, II の阻害剤。糖タンパク質のフォールディングを妨げることで作用範囲の広い抗ウィルス活性を示します。また、可逆的に哺乳類の雄の不稔性を引き起こします。細胞増殖は阻害しません。						
Castanospermine, *Castanospermum australe*	79831-76-8	189.2	≥ 98% by TLC	+4℃	H_2O (1 mg/ml)	218775-1MG	11,900
[(1S,6S,7R,8aR)-Tetrahydroxyoctahydroindolizine]	複数の β- グルコシダーゼおよび α- グルコシダーゼ（N- 結合型糖タンパク質プロセシングに関与するものを含む）に対する植物アルカロイド系阻害剤です。生成するオリゴ糖は、主に $Glu_3Man_{7-9}(GlcNAc)_2$ です。本品は、内皮細胞の移動および基底膜の浸潤を阻害します。抗ウイルス作用を示します。通常は 1-10 µg/ml の濃度で使用します。						
Conduritol B Epoxide	6090-95-5	162.1	≥ 97% by TLC	-20℃	DMSO or H_2O	234599-100MG	55,000
(CBE)	本品は、哺乳類、巻貝類、スイートアーモンド、および酵母における α- グルコシダーゼ活性を阻害します。培養ニューロン内のグルコセレブロシダーゼに対する、不可逆的かつ強力な特異的阻害剤です。酵母由来 α- グルコシダーゼおよびウサギ腸管スクラーゼ - イソマルターゼ複合体に対しても阻害作用を示すことが明らかになっています。						
Deoxygalactonojirimycin, Hydrochloride	75172-81-5	199.6	≥ 98% by TLC	-20℃	H_2O	259544-5MG	42,900
(DGJ; 1,5-Dideoxy-1,5-imino-D-galactitol; Galactostatin, HCl)	強力かつ選択的な α- ガラクトシダーゼ阻害剤。						
2-Deoxy-D-galactose（1.24798）	1949-89-9	164.2	≥ 99% by GC	room temp.	H_2O (5 mg/ml)	259580-1GM	24,000
	ラットガングリオシド GM_2 および GD_3 中の通常はガラクトースが占めている位置に取り込まれることができるヘキソースアナログ。2- デオキシ -D- ガラクトースは、フコシル化の阻害剤として働くことが示唆されています。また、アナダリン P レクチン（血液由来のガラクトシル結合レクチン）の競合的溶出にも用いられています。						
1-Deoxymannojirimycin, Hydrochloride	84444-90-6	199.6	≥ 98% by TLC	-20℃	Ethanol (1 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	260575-5MG	28,900
(1,5-Dideoxy-1,5-imino-D-mannitol, HCl; DMJ)	高マンノース型から複合型へのオリゴ糖鎖の変換を抑制する、特異な α- マンノシダーゼ I 阻害剤。						
1-Deoxynojirimycin, Hydrochloride	73285-50-4	199.6	≥ 98% by TLC	+4℃	H_2O (100 mM)	260684-10MG	47,900
(DNJ, HCl)	特異的グルコシダーゼ阻害剤。N- 結合型グリカン生合成において前駆体 Glc_3Man_9-$GlcNAc_2$ から連続した 3 つのグルコース残基を除去する酵素であるトリミンググルコシダーゼ I および II に特異性を示します。						
Glucagon Receptor Antagonist II		467.8	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (45 mg/ml) or Ethanol (45 mg/ml)	346003-5MG	34,900
[L-168,049; 2-(4-Pyridyl)-5-(4-chlorophenyl)-3-(5-bromo-2-propyloxyphenyl) pyrrole]	選択的、非競合的かつ高親和性のグルカゴン受容体アンタゴニストとして作用する細胞透過性のトリアリールピロール化合物（ヒト、マウスおよびイヌの受容体に対して、それぞれ IC_{50}=3.7 nM、63 nM および 60 nM。5 mM の $MgCl_2$ 存在下ではヒト、マウスおよびイヌの受容体に対して、それぞれ IC_{50}=179 nM、331 nM および≥ 1 µM）。GLP-1 受容体および試験した他の GPCR に対しては、ほとんど親和性を示しません。また、p38 キナーゼ活性に対してはわずかに影響を示します（IC_{50} = 1.44 µM）。Gαs への GTPγS の結合（IC_{50}=158 nM）および、hGLUR-CHO 細胞におけるグルカゴン誘導性のアデニル酸シクラーゼ活性化を強力に阻害します（IC_{50}=41 nM、Kb=25 nM）。齧歯動物モデルにおいて経口投与により活性が得られることが示されています。						
Glucose Transporter Inhibitor III, STF-31	724741-75-7			+2℃～+8℃	DMSO	351801-10MG	18,900
Glycogen Phosphorylase Inhibitor	648926-15-2	412.8	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml)	361515-1MG	21,900
[1-(3-(3-(2-Chloro-4,5-difluorobenzoyl) ureido)-4-methoxyphenyl)-3-methylurea]	細胞透過性の尿素化合物。グリコーゲンフォスフォリラーゼ（GP）に対する強力な AMP 競合阻害剤として作用します [IC_{50}=53 nM（ヒト肝 GP-a）、380 nM（ラット肝細胞）]。Wistar ラット（5 mg/kg, iv）においてグルカゴン誘導性グリコーゲン分解時に血糖値を低下させることが明らかになっています。						
β-Hexosaminidase Inhibitor	281224-40-6	479.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (1 mg/ml)	376820-10MG	29,000
M-31850	細胞透過性のビスナフタルイミド化合物。ヒト β-N- アセチルヘキソサミニダーゼに対する基質競合的かつ選択的な阻害剤として作用し（hHex A および hHex B に対する IC_{50} = 6.0 および 3.1 µM）、Jack Bean や細菌の Hex に対してははるかに弱い作用を示し（JBHex および SpHex に対する IC_{50} = 280 および >500 µM）、SmHex および hOGN に対しては作用を示しません。薬理学的シャペロンとして機能し、ISD および ATSD 患者由来の細胞において変異型 Hex α サブユニットの ER からリソソームへの輸送を強力に促進することが知られています。						
Kifunensine, *Kitasatosporia kifunense*	109944-15-2	232.2	≥ 98% by TLC	-20℃	Hot H_2O (25 mg/ml)	422500-1MG	53,900
	マンノシダーゼ I の強力なアルキロイド阻害剤。マンノシダーゼ II および小胞体の α- マンノシダーゼは阻害しません。						
DL-threo-PDMP, Hydrochloride	80938-69-8	427	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO, methanol, or ethanol	513100-50MG	37,900
(1-Phenyl-2-decanoylamino-3-morpholino-1-propanol, HCl)	PDMP は脳グルコシルトランスフェラーゼの天然スフィンゴ脂質基質に極めて似ており、この酵素の強力かつ競合的な阻害剤として作用します。神経突起の成長を妨げ、培養 NIH/3T3 細胞の糖脂質合成を阻害します。						
Swainsonine, *Swainsona canescens*	72741-87-8	173.2	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml), H_2O (1 mg/ml), or Chloroform	574775-500UG	16,900
[8aβ-Indolizidine-1α,2α,8β-triol; (1S,2S,8R,8aR)-Trihydroxyindolizidine]	可逆的なリソソーム α- マンノシダーゼの活性部位阻害剤。マウスモデルにおいて、腫瘍成長を阻害し、転移を防ぎます。高マンノースのコンプレックス型オリゴ糖へのプロセシングを妨げます。						
Tunicamycin, *Streptomyces lysosuperficus*	11089-65-9	840.9	≥ 95% by HPLC (A+B+C+D)	room temp.	DMSO (10 mg/ml), DMF, or Pyridine. Aqueous solutions can be prepared from DMSO stock solutions by diluting in H_2O at pH 8.0 to 10.0 or with appropriate buffers at pH >7.0.	654380-10MG	27,000
						654380-50MG	52,000
	N 結合グリコシル化を阻害し、N- グリコシド・タンパク質 - 糖質結合の形成を妨げるヌクレオシド系抗生物質。グラム陽性菌、酵母、真菌およびウイルスに対し、*in vitro* で活性を示します。ヒト T リンパ芽球状細胞上に機能的なトロンビン受容体が発現するのを阻害します。また、細胞のトロンビン誘導性 Ca^{2+} 動員を阻害します。						

Adenyl Cyclase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Angiotensin II, Human	4474-91-3	1046.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	5% acetic acid（1 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	05-23-0101-1MG	4,900
						05-23-0101-5MG	8,900
						05-23-0101-25MG	23,900
（DRVYIHPF）	血圧の調節において重要な役割を果たします。副腎からのアルドステロンの放出を刺激します。強力な血管収縮作用を有します。電位感受性チャネルを介した心筋への Ca^{2+} 流入を増加させ、ミオシン軽鎖キナーゼを活性化します。また、ニューロンにおける電位依存性の遅延整流性 K^+ 電流の増加を誘発します。平滑筋細胞において JAK2 を活性化します。ラット上皮細胞において、115-120 kDa のカルシウム依存性細胞質チロシンキナーゼおよび $p125^{FAK}$ を活性化します。また、$p60^{c\text{-}src}$ ならびに血管平滑筋細胞における ERK1/2、JNK、および p38 MAP Kinase も活性化します。高血圧自然発症ラットにおけるアデニル酸シクラーゼ活性を阻害します。						
Adenylyl Cyclase Type V Inhibitor, NKY80		229.2	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）or Methanol（5 mg/ml）	116850-5MG	17,000
						116850-25MG	59,000
[2-Amino-7-（furanyl）-7,8-dihydro-5（6H）-quinazolinone]	$G_s\alpha$ GTPγS- ホルスコリンの存在下で、アデニリル・シクラーゼ（AC）タイプ V イソ型（IC_{50} = 8.3 μM、132 μM、1.7 mM、それぞれタイプ V、III、II 用）の有効な選択的阻害剤として働く非核酸化合物を含む細胞透過性のキナゾリノン。タイプ II イソ型に対してタイプ V の 210 倍高い選択性を示します。ATP とホルスコリンに対してこの阻害は非競合性です。心臓組織と肺組織において AC 触媒作用を制御します。						
2',5'-Dideoxyadenosine	6698-26-6	235.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	288104-1MG	15,900
（2',5'-dd-Ado）	アデノシン P1 結合部位に結合する、細胞膜透過性の非競合的アデニル酸シクラーゼ阻害剤です（IC_{50} = 3 μM）。β- アドレナリンアゴニストの陽性変力効果および陽性変時効果を抑制します。						
MDL-12,330A, Hydrochloride	40297-09-4	377	> 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml），Ethanol（5 mg/ml），or H_2O（3 mg/ml）	444200-1MG	11,900
[*cis*-N-（2-Phenylcyclopentyl）azacyclotridec-1-en-2-amine, HCl]	細胞浸透性かつ不可逆的なアデニル酸シクラーゼ阻害剤（IC_{50} = 250 μM）。						
SQ 22536	17318-31-9	205.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）or H_2O（5 mg/ml）	568500-5MG	27,900
[9-（Tetrahydro-2'-furyl）adenine]	細胞浸透性のアデニル酸シクラーゼ阻害剤。アデニル酸シクラーゼの PTH 刺激作用をブロックします（IC_{50} = 200 μM）。PGE_2 が誘導する O_2^- 産生の阻害を低減します。						

MAPK Family Pathway



阻害剤関連製品の最新情報はこちらから >> www.merckmillipore.jp/sogaizai
ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

CFTR 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
CFTR Inhibitor-172	307510-92-5	409.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	219670-5MG	28,000
CFTR Inhibitor II, GlyH-101		493.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（200 mg/ml）	219671-5MG	33,900
[N-（2-Naphthalenyl）-（（3,5-dibromo-2,4-dihydroxyphenyl）methylene）glycine hydrazide]	細胞透過性のグリシニルヒドラゾン化合物。中間の速度をもつ CFTR の強力かつ選択的な可逆性開口チャンネル阻害剤として作用し（1 分未満、50 μM で 95% の阻害、K_i=4.3 μM、CFTR 発現 FRT 細胞における頂端膜 Cl^- 電流のデータ）、望ましい水溶性を示します。平均チャンネル開口時間を抑え、内向き整流性 CFTR Cl^- 電流を生じることが示されており、膜の細胞外側で直接チャンネル孔と相互作用することが示唆されています。P 糖タンパク質および非 CFTR 媒介性の Cl^- 電流に対してはほとんど影響を示しません。*in vivo* では鼻および腸管の上皮において効果的です。						
CFTR-F508del Corrector, KM11060		422.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	219676-5MG	21,000
	細胞透過性のスルフォニルピペラジン化合物。BHK および CFBE41o 細胞において Sildenafil よりはるかに強力に時間依存的に機能的 F508del-CFTR トラフィッキングを部分的かつ可逆的に救済します。cGMP 特異的フォスフォジエステラーゼ V 活性を阻害することによって小胞体（ER）のレベルでトラフィッキングを正常化し、F508del-CFTR のリン酸化および ER 保持低下をもたらすことが示唆されています。						

GPCR、イオンチャネル

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
D-Amino Acid Oxidase Inhibitor	39793-31-2	167.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (80 mg/ml) or 5% NaOH (25 mg/ml)	138000-50MG	19,900
	細胞透過性のチエノピロール化合物。CHO 細胞において形質移入された D- アミノ酸オキシダーゼ（DAO/DAAO/DAMOX/OXDA）の細胞内活性を強力に阻害（ヒトおよびラット DAO に対する IC_{50} はそれぞれ 145 および 114 nM）しますが、D- アスパラギン酸オキシダーゼ（DDO、IC_{50} >5 μM）、P450 酵素 CYP3A4/2D6/3C9（IC_{50}>10 μM）、および 150 種以上の他の酵素、受容体、およびイオンチャンネルからなるパネルに対しては影響しません。*in vivo* において、腹腔内投与（200 mg/kg）によりラット脳および腎臓の DAO 活性が効果的に阻害されること（それぞれ 96% および 80%）が明らかですが、その結果生じる末梢および中枢神経系における D- セリン濃度の上昇は、抗精神病薬作用や認知機能改善作用には不十分だと考えられています。						
D-Amino Acid Oxidase Inhibitor II, CBIO	61977-29-5	169.6	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	138001-50MG	18,000
BCRP Inhbitor		405.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	197226-10MG	24,000
N-(4-(2-hydroxyethyl)phenyl)-2-(4-nitrobenzamido)benzamide	ノボビオシン（IC_{50} = 65 μM）よりも 50 倍有効な、安定的にトランスフェクションされた MDCK BCRP 細胞におけるヘキスト 33343 アッセイの 1.39 μM の IC_{50} を示し、10 μM までの濃度で他の ATP 結合カセット・トランスポーター（ABC）に対して影響を全く示さない、アントラニル酸の骨格に基づいた非テトラヒドロイソキノリン BCRP 特異的阻害剤。BCRP の特異的基質フェオホルビド A ならびにイマチニブが存在する酵素動態アッセイにおけるアロステリック阻害剤の役割を示し、濃度 10 μM までの細胞生存性について減少に繋がっていません。						
Calcium-activated Chloride Channel Inhibitor, CaCCinh-A01		347.43	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO	208293-10MG	38,900
CFTR-F508del Corrector II, Corr-4a	421580-53-2	457	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	219673-10MG	23,000
N-(2-(5-Chloro-2-methoxy-phenylamino)-4′-methyl-[4,5′]bithiazolyl-2′-yl)-benzamide, Corr-4, Cystic Fibrosis Transmembrane Conductor Regulator Mutant Corrector II	N1303K-CFTR、P574H-CFTR、M345T-DRD4（ドーパミン受容体 4）または G268V-ABCA1/CD243 /MDR1/ P-gp 変異体に対して修正効果はほとんど示さない一方、直接結合により CFTR δF508 変異体の折りたたみ異常を救出／修正し、δF508 ホモ接合体患者からトランスフェクト細胞と初期の気道上皮細胞の両方で適切な輸送／グリコシル化ならびに表面発現を促進すると報告されている細胞透過性 bisaminomethylbithiazole 化合物。δF508（FRT 細胞で 10μM のときに 3 倍）ならびに野生型 CFTR（最大 70%）の折りたたみ効率を高め、コアグリコシル化された δF508（FRT 細胞で 10μM のときに 30%）の ER 関連の分解を遅らせ、細胞膜の低体温の救出された δF508 変異体の安定性を高める（FRT 細胞で 10μM のときに 1.7 倍）と報告されています。Corr-4a は、FRT ならびに A549 δF508-CFTR トランスフェクタントにおけるホルスコリン刺激性 CFTR 活性を回復するのに VRT-325/CFcor-325 よりも効果的であることが示されています。VRT-532 とは異なり、Corr-4a は変異体 CFTR チャネル開閉活性に影響しません。						
MARK/Par-1 Activity Inhibitor, 39621		395.5	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO	454870-10MG	38,900
MRP1 Inhibitor II, Reversan		442		+4℃	DMSO (10 mg/ml)	475730-10MG	31,000
	選択的に MRP1 を阻害する細胞透過性ピラゾロピリミジン。神経芽細胞主（相乗ならびにヒトの異種移植）のマウスモデルにおいてこれらふたつの MRP1 基質薬のどちらかに対し、それぞれ 10 ～ 15 倍、7 ～ 10 倍のビンクリスチンならびにエトポシドの有効性が増加することが示されます。多剤輸送体の阻害剤の多くとは異なり、Reversan はそれ自身で毒性ではなく、マウスにおける化学療法の薬剤暴露の毒性を増加させることもありませんでした。そのため、Reversan は新しいクラスの非毒性 MRP1 阻害剤であり、神経芽細胞腫やその他の MRP1 過剰性の薬物無効性腫瘍の研究に役立つ研究ツールになる可能性があります。						
NF023		1162.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O	480415-10MG	35,900
{8,8′-[Carbonylbis(imino-3,1-phenylene)]bis-(1,3,5-naphthalenetrisulfonic Acid), 6Na}	G_o/G_i グループの α サブユニットに対して、選択的かつ直接的な G タンパク質アンタゴニストとして働くスラミン類似体（EC_{50} = 約 300 nM）。GTPγS が組換え G タンパク質 α- サブユニットに結合するのを抑制します。これはアゴニスト特異的な三元複合体（アゴニスト / 受容体 /G タンパク質）の形成を阻害することによるものです。NF023 は α- サブユニットと βγ- ダイマーとの間の相互作用は妨げず、エフェクターの結合部位と競合します。また、P2X 受容体アンタゴニストとしても働きます（ラット筋肉の P2X1 受容体に対しては IC_{50} = 0.24 μM、P2X3 に対しては 8.5 μM）。						
NF449	389142-38-5	1505.1	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O	480420-10MG	40,900
{4,4′,4″,4‴-[Carbonyl-*bis*[imino-5,1,3-benzenetriyl *bis*-(carbonylimino)]]*tetrakis*-(benzene-1,3-disulfonic Acid, 8Na)}	強力な $G_s\alpha$- サブユニット選択的 G タンパク質アンタゴニスト。$G_s\alpha$-s- サブユニットへの GTPγS の結合率を抑制しますが（IC_{50} = 140 nM）、$G_s\alpha$-1 サブユニットには影響しません。S49 *cyc*- 細胞（内在性 $G_s\alpha$ サブユニットを欠損）において、外因的に加えた $G_s\alpha$- サブユニットによるアデニル酸シクラーゼ活性の刺激作用を阻害します。また、G_s への β- アドレナリン受容体のカップリングを妨げます（EC_{50} = 7.9 μM）。						
NAADP Receptor Modulator		308.1	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml) or H_2O (100 mg/ml)	481919-25MG	34,000
(1-Carbamoylmethyl-3-carboxy-pyridinium iodide)	細胞透過性のニコチン酸アナログ。NAADP が誘導する Ca^{2+} 放出の選択的アンタゴニストとして作用するほか、より高い濃度では NAADPR（ニコチン酸アデニンジヌクレオチドリン酸受容体）に対する弱いアゴニスト活性も示します。弱い NAADPR リガンドであり（0.2 nM NAADP に対する競合結合において IC_{50}=90 μM）、ウニ卵子ホモジェネートおよびマウス膵臓腺房細胞において NAADP が媒介する Ca^{2+} 反応を特異的に阻害しますが、cADPR、IP3 またはアセチルコリンの誘起によるものには影響しません。						
SB 328437		378.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	559406-1MG	15,000
						559406-5MG	62,000
[(S)-Methyl-2-naphthoylamino-3-(4-nitrophenyl) propionate]	非常に強力かつ選択的な CC ケモカインレセプター 3（CCR3）アンタゴニスト。エオタキシン、エオタキシン 2 または MCP-4 によって誘導されるカルシウム動員をそれぞれ 38、35 および 20 nM の IC_{50} 値で阻害します。また、エオタキシン、エオタキシン 2 および MCP-4 が媒介する走化性を阻害します（IC_{50} 値：それぞれ 32、25 および 55 nM）。						
Na^+/H^+ Exchanger Isoform-1 Inhibitor		340.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	567500-5MG	26,900
[(4-Cyanobenzo[b]thiophene-2-carbonyl) guanidine, methanesulfonate; NHE-1 Inhibitor]	細胞透過性のアシルグアニジン化合物。hNHE-1 を発現する PS120 変異細胞において NHE-1 を IC_{50}=2.0 μM で阻害します。心筋虚血・再灌流のラットモデルにおいて心臓保護をもたらすことが示されています。						

Heat Shock Protein 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
17-AAG	75747-14-7	585.7	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml) or Methanol (10 mg/ml)	100068-500UG	48,900
[17-AG; 17-(Allylamino)-17-demethoxygeldanamycin; 17-Allylaminogeldanamycin; NSC-330507]	より毒性が低く、強力な Geldanamycin（製品番号 345805）の合成誘導体。Hsp90 に結合し（EC_{50}=7.2 μM）、その機能を調節します。腫瘍細胞に対しアポトーシスを誘導（(SKBR3 に対し IC_{50}=4.1nM、MCF7 に対し 5.2nM）。がん遺伝子発現細胞を阻害（erbB - 1、erbB - 2 細胞に EC_{50}=45 nM、mutant p53 細胞に EC_{50}=62 nM、Raf - 1 細胞に EC_{50}=80 nM）、Akt 細胞 Ras/Raf/MEK および PI3 - kinase シグナル伝達経路を阻害します。また、がん細胞の抗がん剤（パクリタキセル（製品番号 580555）、ドキソルビシン（製品番号 324380）に対する感受性を高め、VEGF の発現を抑制します。						
17-DMAG		653.2	≥ 95% by TLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or H_2O (10 mg/ml)	100069-500UG	49,000
(17DMAG; 17-Desmethoxy-17-N,N-dimethylaminoethylamino-geldanamycin, HCl; 17-N,N-Dimethylaminoethylamino-17-demethoxy-geldanamycin, HCl; NSC 707545)	ヒト Hsp90α の ATPase 部位に高い親和性で結合する 17-AAG（製品番号 100068）の強力な抗腫瘍性アナログ（NCI 60 細胞パネル *in vitro* 活性スクリーニングにおいて、17-DMAG に対する GI_{50} = 51 nM、17-AAG に対しては 120 nM）。優れた生理的吸収性と水溶性を示します。						
Heat Shock Protein Inhibitor I		245.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (3 mg/ml) or Olive oil	373260-5MG	31,900
(*N*-Formyl-3,4-methylenedioxy-benzylidine-γ-butyrolactam; KNK437)	Hsp70 および Hsp72 の誘導を阻害し、温度耐性を用量依存的に阻止するベンジリデンラクタム化合物。非耐性細胞の熱感受性には影響しません。Quercetin（製品番号 551600）よりも毒性が低く、効力が高いと報告されています。また Quercetin のように PKA、PKC および PTK 活性に影響することはありません。						
HSP90 Inhibitor, CCT018159	171009-07-7	352.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (35 mg/ml), H_2O (1.7 mg/ml) or Ethanol (35 mg/ml)	385920-5MG	25,900
[4-(4-(2,3-Dihydro-1,4-benzodioxin-6-yl)-5-methyl-1H-pyrazol-3-yl)-6-ethylresorcinol]	細胞透過性のピラゾロレゾルシノール化合物。HSP90β に K_d470 nM で結合し、HSP90 ATPase 活性を ATP 競合的に阻害します（ヒト HSP90β および酵母 HSP90 に対する IC_{50} = 3.2 μM および 6.6 μM）。20 キナーゼパネルにおいて 50 μM で Lck、GSK-3β、PDGFRα、c-Raf および InsR の活性を阻害し（98%、86%、81%、77%および 74%）、HSP72 およびトポイソメラーゼ II ATPase に対しては弱い作用しか示しません。細胞周期停止およびアポトーシスを誘導し、浸潤および血管新生を阻害します。NQO1/DT- ジアフォラーゼおよび P-gp 発現とは無関係に増殖抑制作用を示すことが知られています（GI_{50} = 約 5.3 μM）。						

脂質シグナル伝達

Acetyl-CoA Carboxylase（ACC）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Coenzyme A, Trilithium Salt	18439-24-2	785.4	≥ 94% by UV	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	234101-100MG	35,000
	酵素的アセチル転移反応におけるコファクターです。						
TOFA		324.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）. Slight warming and sonication may be required for complete solubilization in ethanol.	613450-5MG	57,900
[5-（Tetradecyloxy）-2-furoic acid]	細胞透過性のフロ酸化合物。脂肪酸生合成に関与する重要な酵素であるアセチル CoA カルボキシラーゼ（ACC）に対する強力かつ可逆的な競合阻害剤として作用します。細胞の脂肪酸合成を用量依存的に阻害します [IC_{50} = 4 µM（ヒト乳がん細胞株 MCF7）]。TOFA 誘導性のマロニル CoA の減少が絶食マウスの摂食量および腫瘍細胞のアポトーシスに対する C75（製品番号 341325）の作用を打ち消すことが報告されています。						

Ceramide Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Ceramide Kinase Inhibitor II, NVP-231		432.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	219493-10MG	39,000
Ceramide Kinase Inhibitor, K1		344.4	≥ 95% by NMR (mixture of enantiomers)	-20℃	EtOH	219489-1MG	47,000

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

Cyclooxygenase（COX）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
COX-1 Inhibitor, FR122047	130717-51-0	460	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml), H_2O (4 mg/ml), or 1 N HCl (2 mg/ml)	236005-5MG	35,000
{4,5-Bis(4-methoxyphenyl-2-[(1-methylpiperazin-4-yl)carbonyl]thiazole, Hydrochloride; 1-[(4,5-Bis(4-methoxyphenyl-2-thiazoyl)carbonyl]-4-methylpiperazine, Hydrochloride; FR 122047}	細胞透過性のチアゾール３置換化合物で、COX-1 の強力で選択的な阻害剤（ヒトリコンビナント COX-1 と COX-2 に対しそれぞれ IC_{50} = 28 nM と 65 μM）。COX-1 に対して COX-2 の 2300 倍の選択性を示します。経口での効果が認められており、鎮痛、抗血小板、抗炎症活性を示します。						
COX-1 Inhibitor IV, TFAP	1011244-68-0	281.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	236007-10MG	21,000
N-(5-Amino-2-pyridinyl)-4-trifluoromethylbenzamide	酵素の活性部位を標的にして COX-1 選択的阻害剤（それぞれ羊 COX-1 と COX-2 に対し IC_{50} = 0.80 ならびに 210 μM）として働き、長期の細胞毒性（300 mg/kg を 14 日間マウスに経口投与）なしに *in vivo*（30 mg/kg、経口）マウスとラットで鎮痛作用を示す細胞透過性の pyridinyl-benzamide 化合物。アスピリンのような COX-2 阻害の鎮痛剤と異なり、TFAP は *in vivo* ラットが（300 mg/kg、経口投与）胃損傷を引き起こすことはありません。						
COX-2 Inhibitor I		377.8	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）or MeOH（1 mg/ml）	236011-5MG	46,000
{LM-1685; Methyl [5-methylsulfonyl-1-(4-chlorobenzyl)-1H-2-indolyl]carboxylate}	強力で選択的な COX 阻害剤。ヒト単球 cyclooxygenase-2（COX-2）に（IC_{50} = 650 nM）、全血由来で（IC_{50} = 4.3 μM）。ヒト血小板由来の COX-1（IC_{50} > 10 μM）と全血 COX-1（IC_{50} > 100 μM）には非常に弱い阻害活性を示します。						
COX-2 Inhibitor II		350.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	236012-5MG	33,900
{4-[(5-Difluoromethyl-3-phenyl)-4-isoxazolyl]benzenesulfonamide; SC-791}	*in vitro*（hCOX-2 に対する IC_{50} = 4 nM、hCOX-1 に対しては 114 μM）および *in vivo* の両方で COX-2 の強力かつ非常に選択的な阻害剤として働く、細胞透過性のイソオキサゾリル - ベンゼンスルホンアミド化合物。創傷治癒プロセスにおける COX-2 の役割を研究するために、さまざまな動物モデルで広範に用いられています。						
COX-2 Inhibitor III		422.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（200 mg/ml）or Ethanol（0.5 mg/ml）	236013-25MG	34,900
[N-(5-Acetyl-2-piperidinophenyl)-N'-(2,5-dichlorophenyl)thiourea; BTB 02472]	チオ尿素化合物。COX-2 の活性部位を標的とする阻害剤として作用します。Nimesulide や Celecoxib よりも優れた選択性を示します（10.0 μM の阻害剤濃度における COX-1 および COX-2 の % 阻害は、BTB 02472 では 5.1 および 26.36、Nimesulide では 9.87 および 19.94、Celecoxib では 12.35 および 40.37）。						
COX-2 Inhibitor V, FK3311	116686-15-8	341.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（30 mg/ml）or Ethanol（15 mg/ml）	236015-5MG	30,000
	細胞透過性のスルフォンアニリド化合物。COX-1 に対するより約 500 倍高い選択性で COX-2 を強力に阻害します。抗炎症作用、鎮痛作用および解熱作用を示し、潰瘍を誘発しません。ラット腹膜好中球においてザイモサン誘導性の PGE_2 産生を抑制することが知られており（0.1μg/ml で 45%）、複数の動物モデルで虚血再灌流傷害に対する保護作用を示すことが報告されています。						
Curcumin, *Curcuma longa L.*	458-37-7	368.4	≥ 80% by HPLC	room temp.	Acetic acid（10 mg/ml）or DMSO（5 mg/ml）	239802-100MG	10,900
[1,7-Bis(4-hydroxy-3-methoxyphenyl)-1,6-heptadiene-3,5-dione]	5- リポキシゲナーゼ（IC_{50} = 8 μM）およびシクロオキシゲナーゼ（IC_{50} = 52 μM）の阻害剤として作用する抗腫瘍性抗炎症剤。活性化マクロファージにおける一酸化窒素合成酵素の誘導も阻害します（IC_{50} = 6 μM）。最近、ヒト扁平上皮がん A431 細胞における EGF 受容体の内因性キナーゼ活性を用量・時間依存的に阻害することが報告されています。						
Diclofenac Sodium	15307-79-6	318.1	≥ 98% by TLC	room temp.	H_2O（25 mg/ml）	287840-1GM	8,000
{2-[(2,6-Dichlorophenyl)amino]benzeneacetic Acid, Na}	シクロオキシゲナーゼ阻害剤。鎮痛作用を有する非ステロイド系抗炎症剤です。また、肝臓のフェノールスルホトランスフェラーゼ活性を阻害します（IC_{50} = 約 9.5 μM）。						
Ebselen	60940-34-3	274.2	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）or Ethanol	324483-5MG	18,900
[2-Phenyl-1,2-benzisoselenazol-3(2H)-one; PZ51]	シクロオキシゲナーゼ 1 および 2（COX-1 および COX-2）の非選択的阻害剤。優れたペルオキシ亜硝酸スカベンジャーです。グルタチオンペルオキシダーゼに類似した作用を示します。過酸化物のスカベンジングによって、胸腺細胞における放射線誘導性アポトーシスを阻害します。急性局所性虚血傷害に対して有効な神経保護剤です。LPS によって誘発される NF-κB の核内転位および JNK のリン酸化を阻害します。						
Flurbiprofen	5104-49-4	244.3	≥ 98% by titration	room temp.	DMSO（50 mg/ml）	344079-100MG	11,900
[(±)-2-Fluoro-α-methyl[1,1'-biphenyl]-4-acetic Acid; U-27182]	S(+)型、R(-)型鏡像異性体の混合物。強力なシクロオキシゲナーゼ阻害剤として作用する（ヒト末梢血細胞の LPS 誘導性 COX に対して IC_{50} = 5 nM）、細胞膜透過性の非ステロイド系抗炎症剤です。RAW 264.7 マクロファージにおける iNOS 発現を抑制します。また、強力な抗がん作用を示します。						
NS-398	123653-11-2	314.4	≥ 98% by TLC	room temp.	DMSO（20 mg/ml）	349254-5MG	23,000
[N-(2-Cyclohexyloxy-4-nitrophenyl)methanesulfonamide]	シクロオキシゲナーゼ 2（COX-2）の選択的阻害剤。*in vitro* でヒツジ胎盤 COX-2 を阻害（IC_{50} = 3.8 μM）しますが、COX-1 の活性には 100 μM の濃度でも影響しません。ラットの *in vivo* において 0.3-5 mg/kg の濃度で、強力な抗炎作用と鎮痛作用を示します。						
(±)-Ibuprofen	15687-27-1	206.3	≥ 99% by titration	room temp.	DMSO（5 mg/ml）or Ethanol（1 mg/ml）	401003-1GM	12,900
[(±)-2-(4-Isobutylphenyl)-propionic Acid]	非ステロイド性抗炎症剤（NSAID）で、シクロオキシゲナーゼの競合的可逆的阻害剤 cyclooxygenase 1（COX-1）に対して IC_{50} = 4.85 μM、高濃度で COX-2 も阻害します（IC_{50}=223 μM）。アスピリンによる COX-1 をブロックします（EC_{50} antagonism of 200 μM、aspirin = 290 nM）。神経細胞でβアミロイド（Amyloid $β_{40}$ と $β_{42}$）分泌を抑制し、グルタミン酸、NO、過酸化物によるダメージから保護する作用が知られています。PPAR（peroxisome proliferator-activated receptors）α、γを活性化します（CV-1 および C3H10T1/2 細胞で約 100 μM - 500 μM で作用）。						

脂質シグナル伝達

Cyclooxygenase（COX）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Indomethacin [1-(*p*-Chlorobenzoyl)-2-methoxy-3-methyl-1H-indole-3-acetic Acid]	53-86-1	357.8	≥ 98% by assay	room temp.	Ethanol（20 mg/ml）	405268-10GM	22,900
非ステロイド性抗炎症性解熱剤。非選択的シクロオキシゲナーゼ（COX）阻害剤です（COX-1 に対して IC_{50} = 740 nM、COX-2 に対して IC_{50} = 970 nM）。フォスフォリパーゼ A_2 を阻害します（IC_{50} = 145 μM）。							
Kaempferol (3,4′,5,7-Tetrahydroxyflavone)	520-18-3	286.2	≥ 97% by HPLC	−20℃	DMSO（25 mg/ml）or Ethanol（20 mg/ml）	420345-25MG	21,000
新生児皮質ニューロンを $A\beta_{25-35}$ の誘導による細胞死から保護するフィトエストロゲン。エストラジオールとほぼ同じ保護作用を示します。Aβ によるカスパーゼ -2、-3、-8 および -9 活性の誘導を遮断し、ニューロンのアポトーシスを低下させます。モノアミンオキシダーゼの強力な阻害剤であると報告されています。COX-1 活性の阻害剤として作用します（IC_{50} = 180 μM）。							
ETYA (5,8,11,14-Eicosatetraynoic Acid)	1191-85-1	296.4	＞ 95% by TLC	−20℃	DMSO or Ethanol（20 mg/ml）	434741-20MG	55,900
アラキドン酸の取り込みおよびアラキドン酸特異的、非特異的アシル -CoA 合成酵素の活性を阻害します。ホスホリパーゼ A_2（PLA_2）およびチトクローム P450 を阻害します。ホールセルにおいて、シクロオキシゲナーゼ（ID_{50} = 8 μM）、5- リポキシゲナーゼ（ID_{50} = 10 μM）、12- リポキシゲナーゼ（ID_{50} = 300 nM）、および 15- リポキシゲナーゼ（ID_{50} = 200 nM）を阻害します。また、細胞内への Ca^{2+} 流入の強力な調節因子として作用します。内皮細胞内の低酸化 LDL における単球結合を抑制します。培養下垂体細胞からの黄体形成ホルモン放出を促進します。							
Meloxicam [4-Hydroxy-2-methyl-N-(5-methyl-2-thiazoyl)-2H-1,2-benzothiazine-3-carboxamide-1,1-dioxide]	71125-38-7	351.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	444800-100MG	29,000
オキシカムファミリーの非ステロイド性抗炎症薬（NSAID）。シクロオキシゲナーゼ 2（COX-2; IC_{50} = 4.7 μM）の誘導可能アイソフォームを、シクロオキシゲナーゼ 1（COX-1; IC_{50} = 36.6 μM）よりも選択的に阻害します。*in vitro* で結腸直腸がん細胞の成長を阻害します。							
Nimesulide Analog, Compound 76 N-(3-(2,5-dimethylbenzyloxy)-4-(N-methylmethylsulfonamido)phenyl)cyclohexanecarboxamide	1021926-22-6	444.59	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（25 mg/ml）	482210-5MG	25,000
細胞透過性のスルホンアニリド。3 種類の HER-2 陽性乳癌細胞株 SKBR-3、BT474、および MDA-MB-45 に対しては増殖抑制効果を示すものの（IC_{50} はそれぞれ 0.9、2.2、および 4.0 μM）、2 種類の HER-2 陰性乳癌細胞株 MCF-7 および MDA-MB-231 に対してははるかに高濃度でなければ影響しないことが判明しています（IC_{50} はそれぞれ 22.1 および 19.6 μM）。COX-2 阻害剤とは考えられておらず、細胞における作用標的や増殖抑制機構は不明です。							
5-Nitro-2-(3-phenylpropylamino) benzoic Acid (NPPB)	107254-86-4	300.3	≥ 98% by TLC	room temp.	DMSO（5 mg/ml）or warm Ethanol	484100-10MG	17,000
強力な Cl^- チャネルブロッカーですが（IC_{50} = 100 nM-100 μM）、チャネルのサブタイプとアッセイ方法に依存します。また、シクロオキシゲナーゼを阻害します（IC_{50} = 8 μM）。							
Pterostilbene, *Pterocarpus marsupium* (*trans*-3,5-Dimethoxy-4′-hydroxystilbene)	537-42-8	256.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Methanol（10 mg/ml）	523310-10MG	40,000
細胞透過性を有する Resveratrol（製品番号 554325）のメトキシル化アナログ。抗酸化作用、増殖抑制作用、および血糖降下作用を示します。COX-1（IC_{50} = 19.8 μM）および COX-2（IC_{50} = 83.9 μM）の活性を中程度に阻害し、HL60 細胞においてアポトーシスを誘導します（IC_{50} = 70 μM）。また、DMBA 誘発前がん病変を抑制し（ED_{50} = 4.8 μM）、STZ 誘発糖尿病ラットの血漿グルコース濃度をメトホルミンと同程度に低下させます。							
Radicicol, *Diheterospora chlamydosporia*	12772-57-5	364.8	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or methanol	553400-500UG	19,000
プロテインチロシンキナーゼ阻害物質として作用する抗真菌性大環状ラクトン抗生物質。$p60_v{}^{src}$ キナーゼ活性を阻害します（IC_{50} = 0.27 nM）。LPS 刺激を受けたマクロファージにおいて COX-1 発現に影響することなく COX-2 発現を阻害します（IC_{50} = 27 nM）。Raf キナーゼを選択的に枯渇させて K-Ras 活性化シグナリング経路を遮断します。LPS 刺激を受けたマクロファージの $p53/56^{lyn}$ のチロシンリン酸化を阻害します。MAP キナーゼおよび GAP 結合 p62 などの鍵となるシグナル伝達中間体を遮断することで、*src*、*ras*、および *mos* などの様々な腫瘍遺伝子による NIH/3T3 細胞の形質転換を部分的に抑制します。また *in vivo* で抗血管新生活性を示します。							
Resveratrol (*trans*-3,4′,5-Trihydroxystilbene)	501-36-0	228.2	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	554325-25MG	12,900
ブドウの皮とワインの両方に見られるフェノール系産物。抗真菌性、抗腫瘍性、抗酸化性を有します。シクロオキシゲナーゼ 1（COX-1）の特異的な阻害剤であり（ED_{50} = 15 μM）。COX-1 のヒドロキシペルオキシダーゼ活性も阻害します（ED_{50} = 3.7 μM）。HL-60 細胞において、フォルボールエステルが誘導するフリーラジカルの形成を阻害し（ED_{50} = 27 μM）、また、DMBA で処理した TM677 細胞では、抗突然変異原薬として働きます（ED_{50} = 15 μM）。P450 1A1 の選択的な阻害剤としても作用します。							
SC-560 [5-(4-Chlorophenyl)-1-(4-methoxyphenyl)-3-trifluoromethylpyrazole]	188817-13-2	352.7	≥ 98% by HPLC	−20℃	DMSO（200 mg/ml）	565610-5MG	28,900
シクロオキシゲナーゼ 1（COX-1）の極めて強力かつ選択的な阻害剤（IC_{50} = 9 nM）。非常に高い濃度ではシクロオキシゲナーゼ 2（COX-2）も阻害します（IC_{50} = 6.3 μM）。							
SKF-86002 [6-(4-Fluorophenyl)-2,3-dihydro-5-(4-pyridyl)imidazo[2,1-b]thiazole]	72873-74-6	297.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	567305-5MG	34,000
二環式イミダゾールサイトカイン抑制性抗炎症薬（CSAID）。単核細胞において p38 MAP キナーゼの活性化、およびリポ多糖類（LPS）の刺激による IL-1、TNF-α 合成をブロックすることにより（IC_{50} = 1 μM）、浸透圧ストレスおよび UV 誘導性のアポトーシスを阻害します。また、シクロオキシゲナーゼおよび 5- リポキシゲナーゼの両方に対する阻害剤として作用し、浸透圧ストレスを阻害します。							
Sodium Salicylate (NaSal; Salicylic Acid, Na)	54-21-7	160.1	≥ 98% by titration	room temp.	Ethanol or H_2O（50 mg/ml）	567630-5GM	10,000
非ステロイド系抗炎症剤。IκB-α タンパク質のリン酸化とそれに続く分解を妨げることにより、TNF が誘導する NF-κB の活性化を阻害します。p42（ERK2）および p44（ERK1）MAP キナーゼの TNF 誘導性活性化を選択的に阻害し、また、TNF 誘導性の JNK 活性化も阻害します。p38 キナーゼの活性化を通してアポトーシスを誘導します。NF-κB の活性化とは無関係に、COX-2 および誘導性 NOS（iNOS）転写を阻害します。							
Sulindac Sulfide {(Z)-5-Fluoro-2-methyl-1-[*p*-(methylthio)benzylidene]indene-3-acetic Acid}	32004-67-4	340.4	≥ 98% by TLC	room temp.	DMSO（25 mg/ml）or ethanol（5 mg/ml）	574102-5MG	19,900
Sulindac（製品番号 574100）の活性な代謝産物。Ras 誘導性の悪性形質転換および Ras/Raf に依存したトランスアクチベーションを強力に阻害します。また、Ras が誘導する c-Raf-1 キナーゼの活性化も低減します。前立腺がん細胞株において細胞の増殖を阻害し、アポトーシスを誘導します。プロスタグランジン H シンターゼ 2（PGHS-2; COX-2; ID_{50} = 14 μM）に比べ、シクロオキシゲナーゼ 1 を選択的に阻害します（COX-1; ID_{50} = 500 nM）。							

ご注文に際しての詳細は 142 ページを御覧ください

Diacylglycerol（DAG）Kinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Diacylglycerol Kinase Inhibitor I	**93076-89-2**	**459.6**	**≥ 98% by HPLC**	**room temp.**	**DMSO（4 mg/ml）or Ethanol（12 mg/ml）**	**266785-5MG**	**24,900**
{6-{2-{4-[(*p*-Fluorophenyl) phenylmethylene]-1-piperidinyl}ethyl}-7-methyl-5H-thiazolo(3,2-a) pyrimidine-5-one; R59022}	ジアシルグリセロール代謝を阻害することによって、プロテインキナーゼ C の活性を増強します。フォスフォジエステラーゼまたはフォスファチジルイノシトールキナーゼには作用を及ぼさずにジアシルグリセロールキナーゼを阻害します（IC_{50} = 2.8 µM）。ドパミン D_2 およびヒスタミン H_1 の弱いアンタゴニストであり、強力なセロトニン S_2 アンタゴニストでもあります。						
Diacylglycerol Kinase Inhibitor II	**120166-69-0**	**489.6**	**≥ 98% by HPLC**	**room temp.**	**DMSO（12.5 mg/ml）**	**266788-5MG**	**24,900**
{3-{2-[4-[*bis*-(4-Fluorophenyl) methylene]-1-piperidinyl]ethyl}-2,3-dihydro-2-thioxo-4(1H) quinazolinone; R59949}	単離血小板膜（IC_{50} = 300 nM）およびインタクト血小板（IC_{50} = 120 nM）において触媒ドメインに結合することによって、ジアシルグリセロールキナーゼを阻害します。Diacylglycerol Kinase Inhibitor I のアナログであり、本品のほうが高い活性を示します。プロテインキナーゼ C の役割の解明に有用です。						
RHC-80267		**394.6**	**≥ 98% by TLC**	**room temp.**	**DMSO（25 mg/ml）or ethanol（25 mg/ml）**	**554994-10MG**	**22,900**
[1,6-*bis*(Cyclohexyloximinocarbonylamino) hexane]	イヌの血小板（IC_{50} = 4 nM）および、様々な哺乳類細胞における DAG リパーゼ活性の選択的阻害剤。また、グルコースおよびカルバコールが誘導する膵島細胞からのインスリン放出を阻害します。Angiotensin II（製品番号 05-23-0101）および 6- ケト - プロスタグランジン F1α の ATP 誘導合成の阻害剤。						

HMG-CoA Reductase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Atorvastatin, Calcium Salt	**134523-03-8**	**604.7**	**≥ 97% by HPLC**	**+2℃～+8℃**	**DMSO, MeOH, or EtOH**	**189291-100MG**	**40,000**
Fluvastatin, Sodium Salt	**93957-55-2**	**433.4**	**≥ 98% by HPLC**	**-20℃**	**H_2O（30 mg/ml）, DMSO, Or Methanol**	**344095-25MG**	**45,900**
{(±)-(3R',5S',6E)-7-[3-(4-Fluorophenyl) -1-isopropylindol-2-yl]-3,5-dihydroxy-6-heptenoate, sodium}	合成 HMG-CoA リダクターゼ阻害剤（ヒト肝ミクロソームに対して IC_{50} = 40-100 nM）。抗高コレステロール血症剤として作用します。培養内皮細胞培地の MMP-1 レベルを、時間依存的かつ用量依存的に低下させます。Fe (II) を用いたリポソームの過酸化において、TBA 活性基質の形成を阻害します（IC_{50} = 12 µM）。						
Lovastatin	**75330-75-5**	**404.5**	**≥ 95% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO（50 mg/ml）or Ethanol（25 mg/ml）**	**438185-25MG**	**27,900**
（Mevinolin; MK-803）	抗高コレステロール血症薬であり、かつ 3- ヒドロキシ -3- メチルグルタリルコエンザイム A（HMG-CoA）リダクターゼの阻害剤でもあります。3T3-L1 線維芽細胞と 3T3-L1 脂肪細胞におけるインスリンによる $p21^{ras}$ の活性化、成長因子（インスリンを含む）による活性化が可能な細胞内 Ras の蓄積量を減少させる $p21^{ras}$ のファルネシル化、および N-*ras*- の誘導による神経分化、などの一連をブロックします。プロテアソームを阻害して、細胞周期を後半の G_1 期で停止させます。HIRcB 細胞におけるインスリンによる MAP キナーゼの刺激を阻害し、THP-1 由来マクロファージにおける I 型 SCR 遺伝子の転写を遮断することが示されています。また PDGF 受容体チロシンリン酸化、および PDGF による MAP キナーゼの活性化も遮断します。無細胞系で使用するには、活性化する必要があります。単離細胞と共に使用する場合、使用法によっては活性化を要することもあります。						
Lovastatin, Sodium Salt		**444.5**	**≥ 95% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（100 mg/ml）or Ethanol（50 mg/ml）**	**438186-5MG**	**37,900**
	Lovastatin（製品番号 438185）のカルボキシル酸体で、細胞系および無細胞系アッセイで活性。						
Mevastatin	**73573-88-3**	**390.5**	**≥ 95% by HPLC**	**+4℃**	**Ethanol**	**474700-50MG**	**25,900**
（Compactin）	HMG-CoA レダクターゼの強力な阻害剤として作用することにより、Ras ファルネシル化を抑制する抗生物質です。筋芽細胞の融合を阻害します。骨形態発生タンパク質 -2（BMP-2）を誘導することもあります。G_1 期の後半で細胞周期を停止させます。						
Mevastatin, Sodium Salt		**430.5**	**≥ 98% by TLC**	**-20℃**	**DMSO（30 mg/ml）or Ethanol（20 mg/ml）**	**474705-5MG**	**25,900**
	Mevastatin（製品番号 474700）のカルボン酸型。全細胞および無細胞系での分析において活性を示します。						
Pravastatin, Sodium Salt	**81131-70-6**	**446.5**	**≥ 98% by HPLC**	**+4℃**	**H_2O（100 mg/ml）**	**524403-25MG**	**19,900**
{(βR,δR,1S,2S,6S,8S,8aR)-1,2,6,7,8,8a-Hexahydro-β,δ,6-trihydroxy-2-methyl-8[(2S)-2-methyl-1-oxobutoxyl]-1-naphthaleneheptanoic Acid Na; 3β-Hydroxycompactin, Na}	HMG-CoA（3-hydroxy-3-methylglutaryl coenzyme A）還元酵素の水溶性競合的阻害剤で、コレステロールの *in vivo* 生合成を強力にブロックします（K 約 1 nM）。心臓保護作用をもちます。 免疫修飾作用を有し、ras p21 のイソプレニル化を阻害します。						
Simvastatin	**79902-63-9**	**418.6**	**≥ 98% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO or Ethanol（50 mg/ml）. Dissolve 50 mg in 1 ml in ethanol and add 0.813 ml of 1N NaOH. Adjust the pH to 7.2 by adding small quantities of 1N HCl before use.**	**567020-50MG**	**34,000**
（MK-733）	脂肪親和性 3- ヒドロキシ 3- メチルグルタリル補酵素 A（HMG-Co A）リダクターゼ阻害剤。ファルネシル化の阻害を通して Ras 機能をブロックします。また、ラット島 β 細胞の L 型 Ca^{2+} チャネルをブロックすることにより、グルコース誘導性の Ca^{2+} シグナリングおよびインシュリンの分泌を阻害。ヒト平滑筋細胞の細胞増殖を阻害します。						
Simvastatin, Sodium Salt		**458.6**	**≥ 95% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（100 mg/ml）or ethanol（25 mg/ml）**	**567021-5MG**	**34,000**
	Simvastatin（製品番号 567020）のカルボン酸エステル型。全細胞および無細胞系で活性を示します。						

脂質シグナル伝達

Lipoxygenase（LOX）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Baicalein （5,6,7-Trihydroxyflavone）	491-67-8	270.2	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO（20 mg/ml）or Acetone	196322-10MG	22,000
	12- リポキシゲナーゼ（IC_{50} = 120 nM）および逆転写酵素の活性を阻害するフラボン。ロイコトリエンの生合成を抑制し、リソソーム酵素の放出を阻害します。また、細胞の Ca^{2+} の取り込みおよび移動、アジュバント誘発関節炎も阻害します。鉄・バイカレイン複合体を形成することによってミクロソームの脂質過酸化を阻害することが報告されています。肝細胞がん細胞株において、トポイソメラーゼ II を阻害し、細胞死を誘導します。神経刺激に対する収縮反応を増強します。タンパク質チロシンキナーゼおよび PMA 刺激プロテインキナーゼ C を阻害します。						
Caffeic Acid （3,4-Dihydroxycinnamic Acid）	331-39-5	180.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（200 mg/ml）or Ethanol（50 mg/ml）	205546-500MG	12,000
	天然の食品化合物。抗発がん作用および抗炎症作用を有することが報告されています。5- リポキシゲナーゼの選択的な非競合的阻害剤です（ID_{50} = 3.7 µM）。 Cu^{2+} 誘導性 LDL 酸化を開始期において阻害しますが、増殖期においては酸化促進剤として作用します。グルタチオン S- トランスフェラーゼの不可逆的阻害剤であり、キサンチンオキシダーゼの非競合的阻害剤でもあります。						
Eicosapentaenoic Acid （C20:5 ω-3; 5,8,11,14,17-Eicosapentaenoic Acid; EPA）	10417-94-4	302.5	≥ 99% by GC	-20℃	Methanol（1 mg/ml）	324875-25MG	24,900
	心血管疾患および炎症に対する有益な作用を有することが示されています。細胞内遊離 Ca^{2+} の増加を誘発します。5- リポキシゲナーゼを阻害し、トロンボキサン A_2 産生および血液粘度を低下させます。膵癌細胞株においてアポトーシスを誘導し、肝転移を阻害することが報告されています。						
Ketoconazole {*cis*-1-Acetyl-4-[4-[[2-（2,4-dichlorophenyl）-2-（1H-imidazol-1-ylmethyl）-1,3-dioxolan-4-yl] methoxy]phenyl]piperazine; R-41400}	65277-42-1	531.4	≥ 98% by HPLC	+4℃		420600-50MG	22,000
	ステロイドの生合成におけるチトクローム P-450 阻害剤。強力な抗転移、抗腫瘍、抗乾癬作用を示す抗真菌剤。5- リポキシゲナーゼ dffd（5-LO; IC_{50} = 26 µM）、およびトロンボキサンシンセターゼ活性の阻害剤としても作用します。						
MK-886 {3-[1-（*p*-Chlorobenzyl）-5-（isopropyl） -3-*t*-butylthioindol-2-yl]-2,2-dimethylpropanoic Acid, Na}	118414-82-7	494	≥ 99% by TLC	room temp.	DMSO（25 mg/ml）or Ethanol（25 mg/ml）	475889-5MG	25,900
	強力、細胞浸透性かつ特異的なロイコトリエン生合成阻害剤（IC_{50} = 102 nM）。5- リポキシゲナーゼ活性化タンパク質（FLAP）と結合して、5- リポキシゲナーゼの活性を阻害します。しかし、無細胞系では、5- リポキシゲナーゼ活性に影響しません。シクロオキシゲナーゼ、12- リポキシゲナーゼおよび 15- リポキシゲナーゼ経路といった、他のアラキドン酸代謝経路には影響しません。						
NDGA, *Larrea divaricata* （Nordihydroguaiaretic Acid）	500-38-9	302.4	≥ 90% by HPLC	room temp.	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol	479975-250MG	12,900
	抗酸化剤であり、シクロオキシゲナーゼ（IC_{50} = 100 µM）に比べ、リポキシゲナーゼ（LOX）を選択的に阻害します（5-LOX、12-LOX および 15-LOX に対して、それぞれ IC_{50} = 200 nM、30 µM、30 µM）。Swiss/3T3 細胞において、血小板由来増殖因子（PDGF）の刺激による DNA 合成を阻害することが示されています。強力なヒドロキシラジカル抑制剤。						
Ro106-9920	62645-28-7	245.3	≥ 95% by HPLC	-70℃	DMSO（25 mg/ml）or Ethanol（1 mg/ml）	557550-1MG 557550-5MG	19,000 67,000
	テトラゾロピリダジン - フェニル硫酸塩化合物で、抗炎症活性を示します。非常に選択的で、非可逆的な IκBαee ユビキチン化阻害剤（IC_{50} = 2.3 µM）。NF-κB 依存性のサイトカイン産生をヒト PBMN で阻害（TNF-α, IL-1β, IL-6 に対し IC_{50} 約 700 nM）し、マウスでも阻害します。しかし、$SCF^{\beta\text{-}TRCP}$（IκBα ユビキチンリガーゼ）- を介する β カテニンのユビキチン化を Jurkat 細胞で阻害しません。10 µM で 5- リポキシゲナーゼを 89% 阻害し、EGFR キナーゼを 63% 阻害します。						

Phospholipase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
AACOCF3 (Arachidonyltrifluoromethyl Ketone)	149301-79-1	356.5	≥ 97% by TLC	-70℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (50 mg/ml)	100109-10MG	23,900
	アラキドン酸の細胞膜透過性トリフルオロメチルケトンアナログ。細胞質 (85 kDa) フォスフォリパーゼ A_2 ($cPLA_2$; ~20 μM) の強力かつ選択的な slow-binding 阻害剤です。AACOCF$_3$ による $cPLA_2$ 活性の特異的阻害作用は、カスパーゼ活性の阻害を伴わずに TNF 誘導性アポトーシスを部分的に阻害するものです。トロンビン刺激血小板におけるトロンボキサン B_2 産物を大幅に減少させます。また、コラーゲンおよびアラキドン酸に対する血小板凝集反応も阻害します。						
ACA [N-(*p*-Amylcinnamoyl) anthranilic Acid]	110683-10-8	337.4	≥ 99% by TLC	room temp.	Ethanol (10 mg/ml) or DMSO (50 mg/ml)	104550-25MG	24,900
	血小板におけるエピネフリン刺激によるトロンボキサン産生を阻害する細胞膜透過性フォスフォリパーゼ A_2 阻害剤。本品は、肺胞 II 型細胞における ATP 刺激によるフォスファチジルコリン (PC) 分泌を阻害します。また、II 型細胞においてフォルボールエステルおよび A23187 によって誘導された PC 分泌も抑制します。膵 β 細胞によるグルコース誘導性インスリン分泌を抑制することが報告されています。中程度のロイコトリエン拮抗作用を示します。						
Aristolochic Acid	313-67-7	341.3	≥ 97% by HPLC	room temp.	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	182300-50MG	15,000
	アリストロキン酸 I および II の 1:1 混合物。*Aristolochiaceae* 属に存在するフェナントレンカルボン酸誘導体です。様々なヘビ毒に由来するフォスフォリパーゼ A_2 (PLA_2) およびヒト血小板・滑液の PLA_2 を阻害することが報告されています。ヒト好中球におけるイオノフォア刺激 PLA_2 活性を阻害します (IC_{50} = 40 μM)。グループ I PLA_2 よりグループ II PLA_2 に対して強い阻害活性を示します。						
D609, Potassium Salt (Tricyclodecan-9-yl-xanthogenate, K)	83373-60-8	266.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	H_2O (25 mg/ml) and DMSO (25 mg/ml). Note: tissue culture media should be at neutral pH, since product is active only at or slightly below pH 7.0. The compound is inactive at pH 7.4 and above, and it is hydrolyzed below pH 6.0. HEPES buffer shou	251400-5MG	29,900
	フォスファチジルコリン (PC) 特異的フォスフォリパーゼ C の選択的阻害剤 (K_i = 5-10 μM)。フォスファチジルイノシトール特異的フォスフォリパーゼ C、フォスフォリパーゼ A、またはフォスフォリパーゼ D に対しては阻害作用を示しません。また、PLC に対する阻害作用を介して LPS 刺激による ERK 活性化を阻害することも報告されています。基底膜の合成を抑制することによって血管新生を阻害します。						
HELSS [BEL; E-6-(Bromomethylene) tetrahydro-3-(1-naphthalenyl)-2H-pyran-2-one; Haloenol lactone suicide substrate]	88070-98-8	317.2	≥ 98% by TLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml), Ethenol, or Chloroform (25 mg/ml)	374085-5MG	35,900
	カルシウム非依存性フォスフォリパーゼ A2 (PLA2) の強力な細胞透過性不可逆的阻害剤 (IC_{50}=60 nM)。カルシウム依存性 PLA2 とカルシウム非依存性 PLA2 の間で 1000 倍高い選択性を示します。プロスタグランジン E2 の放出を阻害し、グルコースの刺激による膵臓 β 細胞からのインシュリン放出を抑制します。						
Methyl Arachidonyl Fluorophosphonate (MAFP)		370.5	≥ 98% by TLC	-70℃		454565-1MG	21,000
	カルシウム依存性およびカルシウム非依存性サイトソル (85 kDa) フォスフォリパーゼ A_2 (PLA_2) の、選択的かつ非可逆的な活性座位作用性阻害剤です。ただし分泌性 PLA_2 は阻害しません。						
Neomycin Sulfate, γ-Irradiated, Tissue Culture Grade	1405-10-3	908.9		-20℃	H_2O (10 mg/ml)	480100-20ML	11,000
	γ 線照射によって滅菌済。原核生物リボソームの小サブユニットに結合し、翻訳を阻害するアミノグリコシド系抗生物質です。10 mg/ml の溶液を調製するには、20 ml の滅菌脱イオン水に溶解します。						
Neomycin Sulfate	1405-10-3	908.9		room temp.	H_2O (6 mg/ml)	4801-25GM	9,000
	原核生物リボソームの小サブユニットに結合することによって翻訳を阻害するアミノグリコシド抗生物質。最近、アンジオゲニン誘導性の血管形成を阻害することが示されています。神経細胞において Na^+-Ca^{2+} アンチポーターに影響することなく、電位感受性 Ca^{2+} 経路をブロックします。骨格筋筋小胞体 Ca^{2+} 放出の強力なインヒビター。イノシトールリン脂質代謝回転のインヒビター。非特異的フォスフォリパーゼ C インヒビター。また、フォスファチジルコリン - フォスフォリパーゼ D 活性を阻害します (IC_{50} = 65 μM)。ニワトリ絨毛尿膜におけるアンギオゲニン誘導性の血管形成を阻害します (卵 1 つあたり 20 ng)。						
PACOCF3 (Palmitoyl Trifluoromethyl Ketone)	141022-99-3	308.4	≥ 97% by TLC	-20℃	Supplied as a solution in ethanol. To change the solvent, evaporate the ethanol with a stream of nitrogen and immediately reconstitute with the solvent of choice. Soluble in DMSO (30 mg/ml). Only minimally soluble in aqueous buffers; do not use basic buf	506274-5MG	13,000
	Ca^{2+} に依存しない可逆的なフォスフォリパーゼ A_2 (PLA_2) の阻害剤 (IC_{50} = 3.8 μM)。また、非常に高濃度では、Ca^{2+} 依存性 PLA_2 も阻害します (IC_{50} = 45 μM)。						
cPLA2α Inhibitor {N-{(2S,4R)-4-(Biphenyl-2-ylmethyl-isobutyl-amino)-1-[2-(2,4-difluorobenzoyl)-benzoyl]-pyrrolidin-2-ylmethyl}-3-[4-(2,4-dioxothiazolidin-5-ylidenemethyl)-phenyl]acrylamide, HCl}		840	≥ 98% by HPLC	-20℃	75% aqueous acetic acid (5 mg/ml) or DMSO (2 mg/ml)	525143-500UG	49,900
	細胞透過性の 1,2,4- 3 置換ピロリジン誘導体で非常に特異的で強力な cPLA2α (細胞質フォスフォリパーゼ cytosolic phospholipase A2α) の阻害剤 (IC_{50} = 1.8 nM)。A23187- 刺激した THP-1 細胞からのエイコサノイドの放出をブロックします (アラキドン酸に IC_{50} = 22 nM、プロスタグランジン E2 に 31 nM、ロイコトリエン C4 に 13 nM)。AACOCF$_3$ (製品番号 100109) に比べ、酵素アッセイで 230 倍、細胞アッセイで 3900 倍強力な阻害活性を示します。シクロゲナーゼおよび 5- リポキシゲナーゼの活性にはほとんど影響しません。						
sPLA2-IIA Inhibitor I [c(2NapA)LS(2NapA)R, TFA]		864.9	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml)	525145-1MG	28,000
	疎水性の環状 5 アミノ酸ペプチドで、選択的、強力な $sPLA_2$-IIA (human type IIA secreted phospholipase A_2) の阻害剤 (IC_{50} = 12.8 μM)。$sPLA_2$-IIA で誘導される PGE_2 産生を 100 nM でヒト rheumatoid synoviocytes においてブロックし、10μM でも毒性を示しません。ブタ $sPLA_2$-IB, Naja naja $sPLA_2$-IB, ヘビ $sPLA_2$-IIA に対しては 10 μM でも影響を及ぼしません。cyclic(2-NaphthylAla-Leu-Ser-2-NaphthylAla-Arg)・TFA						

脂質シグナル伝達

Phospholipase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Spermine, Tetrahydrochloride	306-67-2	348.3	≥ 99% by titration	room temp.	H_2O (20 mg/ml)	5677-5GM	37,000
	細胞の増殖および分化の調節に重要な役割を果たすポリアミン。NMDA 受容体のサブユニット構成に応じ、刺激効果と抑制効果を示します。フォスフォリパーゼ Cα の阻害剤、およびフォスフォリパーゼ Cδ のアクティベーターとして作用。DNA の断片化および形態的なアポトーシスを阻害します。また、神経細胞の NOS を阻害します。						
U-73122	112648-68-7	464.7	≥ 99% by TLC	room temp.	Anhydrous Chloroform (3 mg/ml), Anhydrous DMSO (1 mg/ml), or Anhydrous Ethanol (500 µg/ml). The use of anhydrous solvents is critical for the solubility of the compound; the presence of moisture in the solvent will lower the solubility of the compou	662035-5MG	21,000
{1-[6-((17β-3-Methoxyestra-1,3,5(10)-trien-17-yl)amino)hexyl]-1H-pyrrole-2,5-dione}	ヒト血小板および好中球において、アゴニスト誘導性のフォスフォリパーゼ C 活性化を阻害します (IC_{50} = 1.0-2.1 µM)。また、ET-1 および副甲状腺ホルモン誘導性の Ca^{2+} 過渡応答を阻害し（それぞれ、IC_{50} = 800 nM および 500 nM）、SK-N-SH 神経芽腫細胞において、ムスカリン受容体のアゴニスト誘導性ダウンレギュレーションを阻害します。生体表面へのヒト多形核好中球による接着の強力な阻害剤として作用します (IC_{50} = 50 nM)。繊維芽細胞単層へのＴリンパ腫細胞の浸潤をなくすことが報告されています。						
U-73343	142878-12-4	466.7	≥ 99% by TLC	room temp.	Chloroform (200 mg/ml), DMSO (2 mg/ml), or Ethanol (1 mg/ml)	662041-5MG	25,900
{1-[6-((17β-3-Methoxyestra-1,3,5(10)-trien-17-yl)amino)hexyl]-2,5-pyrrolidinedione}	U-73122（製品番号 662035）のアナログ。フォスフォリパーゼ C の非常に弱い阻害剤として作用します。ネガティブコントロールとして適しています。						
Autotaxin Inhibitor I, S32826	1103672-43-0	441.45	≥ 97% by HPLC	+4℃	H_2O (0.5 mg/ml)	189510-5MG	23,900
ATX Inhibitor I, (4-(Tetradecanoylamino)benzyl) phosphonic acid disodium, dihydrate	他の 29 種類の受容体と酵素に対して活性が少ない（IC_{50} ~6 µM and 15 µM 、Src と PTP-1B に対して）、あるいはほとんどないことを示す一方、ATX α/β/γ のホスホジエステラーゼ（ATX β を用いた IC_{50} = 9 nM in pNppp アッセイ）と lysoPLD（IC_{50} = それぞれ 5.6 nM ならびに 47 nM、酵素結合の蛍光検出あるいは TLC によるオートラジオグラフィーによる。ATX β 使用）活性を有効に阻害するホスホン酸塩化合物。マウス 3T3F422A 含脂肪細胞 1 （IC_{50} = 90 nM）*in vitro* と培養 *ex vivo* ヒトならびにラットから摘出した脂肪組織（それぞれ 0.2 と 1 µM 時で ~70% 阻害）から LPA 放出を阻害することが示されました。S32826 の *in vivo* 適用性は上皮透過性が低く、薬物速度論的特性の不良により限定的です。CTAB（製品番号 219374）は、S32826 の阻害活性に反作用することが報告されています。2- メチル -2,4- ペンタンジオールは、S32826 阻害アッセイの間に溶液で精製酵素を安定させる代わりに使うことができます。						
Autotaxin Inhibitor II, HA130		463.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	189511-10MG	21,000
ATX Inhibitor II, (Z)-3-((4-((3-(4-Fluorobenzyl)-2,4-dioxo-1,3-thiazolan-5-yliden)-methyl) phenoxy)methyl)benzeneboronic acid	ATX 活性部位スレオニン 210 のボロン部分を標的とするように設計されており、混合型ラインウィーバーバーク動力学で可逆的に ATX lysoPLD 活性（IC_{50} ~28 nM、組換えヒト ATX あるいはヒト血漿を使用）を有効に阻害することを示すチアゾリジンジオン。10 µM もの高い濃度においても NPP1、PDE、AP あるいはプロテアソームのキモトリプシン / トリプシン / カスパーゼ様活性に対して活性はなく、低い細胞毒性（TD50 = 83、HEK293T、A2058、HepG2 培養で 105 ならびに 2056 µM in）を示すと報告されています。HA130 をマウス（463 µg/kg、i.v.）*in vivo* に注入するとすばやく効果的に循環性 LPA レベルを低減しますが、その効果は S32826（製品番号 189510）の場合と同様に長続きしない模様です。						

Sphingomyelinase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
3,4-Dichloroisocoumarin	51050-59-0	215	≥99% by elemental analysis	+4℃	DMF (10 mM) or DMSO (10 mM)	287815-10MG	34,000
	セリンプロテアーゼの強力な不可逆的阻害剤。セリンプロテアーゼと反応することによって、塩化アシル基を遊離させます。この塩化アシル基は、別の活性部位残基をアシル化することができます。グランザイム B を阻害し、エンドヌクレアーゼを必要とせずに胸腺細胞におけるアポトーシス性ヌクレオソーム間 DNA 切断を抑制します。チオールプロテアーゼおよびメタロプロテアーゼには作用を及ぼしません。また、β- ラクタマーゼに対しても活性を示しません。						
Fumonisin B1, *Fusarium moniliforme*	116355-83-0	721.8	≥ 95% by TLC	+4℃	H_2O or Methanol (10 mg/ml)	344850-1MG	19,900
(FB_1)	ラットの腎臓および肝臓ミクロソームにおいて、スフィンゴシン N- アクリルトランスフェラーゼ（セラミドシンセターゼ）を阻害することにより、スフィンゴ脂質の生合成を阻害するマイコトキシンです（IC_{50} = 100 nM)。神経細胞におけるスフィンゴミエリン生合成を選択的に阻害します。発がん性を示します。						
Manumycin A, *Streptomyces parvulus*	52665-74-4	550.7	≥ 96% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml), Methanol or Chloroform	444170-1MG	20,900
	抗腫瘍性を示す抗生物質。ゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ I (GGTase I; IC_{50} = 180 µM) よりもファルネシルトランスフェラーゼ (FTase; IC_{50} = 5 µM) を強力かつ選択的に阻害します。Manumycin は、ファルネシルピロリン酸（FPP）に対しては競合的な（K_i = 1.2 µM)、Ras 受容体タンパク質に対しては非競合的な FTase 阻害剤として作用します。膵臓がん細胞に対して成長および浸潤を阻害することが報告されています。						
N-SMase Inhibitor, GW4869	6823-69-4	577.5	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (200 µg/ml)	567715-1MG	38,900
(GW554869A; GW69A; Sphingomyelinase, Neutral, Inhibitor GW4869)	N-SMase（中性スフィンゴミエリナーゼ）の強力かつ特異的な非競合的阻害剤として働く、細胞浸透性の対称性ジヒドロイミダゾロアミド化合物 [IC_{50}= 約 1 µM（ラット脳)、スフィンゴミエリンに対する K_m= 約 13 µM]。 ヒト A-SMase（酸性スフィンゴミエリナーゼ）は 150 µM でも阻害しません。プロテインフォスファターゼ 2A および lyso-PAF PLC は弱く阻害しますが、細菌のフォスファチジルコリン特異的 PLC は阻害しません。 20 µM 濃度で、MCF7 乳がん細胞における TNF-α またはジアミンに誘導される細胞死から完全に保護することが報告されています。細胞内グルタチオンのレベルは変化させず、また TNF-α やジアミンによるシグナル伝達には影響しません。						
Nα-Tosyl-Phe Chloromethyl Ketone	402-71-1	351.5	≥ 98% by TLC	+4℃	Ethanol (5 mg/ml) or Methanol (5 mg/ml)	616387-250MG 616387-1GM	11,900 28,000
(TPCK)	キモトリプシンの非可逆的阻害剤。トリプシン調製の際、キモトリプシン活性の阻害に役立ちます。胸腺細胞でアポトーシスを阻害します。インターフェロン -γ と LPS によって誘導される一酸化窒素合成酵素の誘導をブロックします（EC_{50} = 20 µM)。						

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
ACC2 Inhibitor, CD-017-0191		381.45	≥ 90% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	104551-10MG	31,000
2-（(2-（4-isopropoxyphenyl）-5-methyloxazol-4-yl）methylthio）oxazolo[4,5-b]pyridine	ヒトアセチル CoA カルボキシラーゼ 2（ACC2）（IC_{50} = 2.8 μM）の細胞透過性の選択的阻害剤。*in vitro* での 100 μM までの濃度ではヒト ACC1 は全く阻害しません。また、未変性の ACC1 遺伝子は濃度が≤ 100 μM のときにヒト ACC2 株に置換されるが、ヒト ACC1 株には置換されない酵母増殖（IC_{50} = 3.8 μM）を阻害することも示されています。この化合物は 10 μM までの濃度のとき培養下のヒト細胞に毒性があることは示されていません。						
Cerulenin, *Cephalosporium caerulens*	17397-89-6	223.3	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）, Ethanol（5 mg/ml）or Acetone	219557-5MG	22,000
	ステロールおよび脂肪酸の生合成を阻害する抗真菌性抗生物質。脂肪酸合成においては、β- ケト - アシル -ACP 合成酵素に等モル比で結合することが報告されています。ステロール合成においては、HMG-CoA 合成酵素活性を阻害します、また、マウスにおいて、摂食を抑制して大幅な体重減少を誘発することも示されています。						
FAAH Inhibitor II	546141-08-6	338.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	EtOH（1 mg/ml）, DMSO（10 mg/ml）, or DMF（10 mg/ml）	341249-5MG	16,000
（3′-Carbamoyl-biphenyl-3-yl-cyclohexylcarbamate; Cyclohexylcarbamic acid-3′-carbamoyl-biphenyl-3-yl Ester; URB597）	細胞透過性のカルバメート化合物で、強力で選択的な、非可逆的な脂肪酸アミド加水分解酵素阻害剤（IC_{50} = 4.6 nM in brain membranes）。アナンダミド anandamide（製品番号 172100）のラット皮質ニューロンにおける分解を抑え（IC_{50} = 500 pM）、脳内の FAAH 活性を阻害し（ID_{50} = 0.15 mg/kg）、ラットに不安情動を誘起します。以下の活性は阻害しません；セリン加水分解酵素 serine hydrolases（IC_{50} > 30 μM）、AChE（acetylcholinesterase）、BCh（butyrylcholinesterase）、MGL（monoglyceride lipase）。また、数種のイオンチャネル、神経伝達物質、カナビノイド受容体 CB1、CB2 へのアナンダミドの結合（IC_{50} > 100 μM）にも影響を及ぼしません。						
FABP4 Inhibitor	300657-03-8	474.6	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）, Methanol（50 mg/ml）, or Ethanol（20 mg/ml）	341310-5MG	32,900
（(2′-（5-Ethyl-3,4-diphenyl-1H-pyrazol-1-yl）(1,1′-biphenyl）-3-yl）oxy）-acetic acid	細胞透過性のビフェニルアゾロ - オキシアセテート。脂肪酸結合ポケットのターゲティングによって脂肪細胞 Fatty-Acid-Binding Protein（aFABP/aP2）の強力な選択的阻害剤として作用し（1,8-ANS を用いた競合結合アッセイにおける K_i ≤ 2 nM）、筋肉および表皮の FABP（Ki = 250 nM および 350 nM）にははるかに低い親和性を示します。*in vitro* で aP2 陽性（aP2 陰性は除く）THP-1 マクロファージにおける泡沫細胞変化および炎症メディエーターの細胞発現を強力に抑制し、*in vivo* でマウスにおけるグルコース代謝およびインスリン感受性を改善することが知られています。						
Fatostatin	121-01-3	375.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	341329-25MG	25,900
2-Propyl-4-（4-（p-tolyl）thiazol-2-yl）pyridine	成熟型 SREBP の転写活性に対する効果がほとんどない SREBP-SCAP（SREBP Cleavage- 活性タンパク質）を ER からのゴルジ体輸送を妨ぐことによって活性の核型（>CHO-K1 細胞において 20 μM 時に 95%阻害）に対する SREBP-1/2（ステロール調節エレメント結合タンパク質 1/2）前駆体の細胞活性を防ぐ細胞透過性の diarylthiazole 化合物。組換え SCAP 切断構造を採用している結合試験は、ファトスタチンは可逆的な方法で aa 448 から 767 の間の SCAP を標的にし、SREBP-SCAP 相互作用に対して影響が無いことが明らかになります。ファトスタチンは、3T3-L1 脂質生成（≤ 20 μg/ml で完全阻害）や IGF1 依存性の DU-145 増殖（IC_{50} = 100 nM）のようなインスリン誘発 SREBP 依存性の細胞機能 *in vitro* を効果的に抑制し、28 日間の処理期間中（1 日 30 mg/kg i.p.）を通して *ob/ob* マウスの血糖値（70%）ならびに体重（12%）を落とすのに、食料摂取量や明らかな副作用に影響を与えることなく、効き目を示します。						
Z-Guggulsterone		312.5	Single spot by TLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	370690-10MG 370690-25MG	30,900 56,000
[GS, *trans*-; *trans*-4,17（20）-Pregnadiene-3,16-dione]	コレステロール低下活性を示す gugul tree 由来の合成ステロイド。						
HDL Receptor SR-BI Inhibitor, BLT-1	321673-30-7	241.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml）	373210-25MG	20,900
33M20	細胞内膜輸送あるいは細胞骨格形成に対してほとんど影響を与えずに、HDL 受容体 SR-BI（スカベンジャー受容体、クラス B、タイプ I）介在の脂質吸収（マウス SR-BI を発現するハムスター IdlA-7 細胞を使い、DiI-HDL と CE-HDL から DiI と CE 吸収に対し IC_{50} = それぞれ 21 ならびに 57 nM）を可逆的に有効的にブロッキングする細胞透過性チオセミカルバゾン銅キレート剤。BLT-1 もまた過剰量の銅を（>4 μM）キレートしたり、銅毒性から胚を救出したりするのに使うことができる一方、化学量論比 2:1 の BLT-1 キレート Cu+2 ならびに CuCl2 と同等の半モルは、ゼブラフィッシュ胚を BLT-1 誘発性の発達異常から完全に防ぎます。						
11β-HSD1 Inhibitor, 10j	1009373-58-3	501.46	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSL（100 mg/ml）	385581-10MG	30,900
	それぞれ酵素含脂肪細胞アッセイとヒト含脂肪細胞アッセイにおける 11β- ヒドロキシステロイド脱水素酵素 1（11β-HSD1）（1.6 nM ならびに 5.3 nM の IC_{50}）の選択的阻害剤として働く細胞透過性スピロ環尿素。鏡像異性体 2 種類で構成されている 10j2（R 異性体）は、上述のアッセイにおいて 10j1（S 異性体）と比べて ~ 2-3 倍有効なことが示されています。10j2（動物経口投与において 10mg/kg）の存在における 11β-HSD1 活性は、媒体処理済コントロールで血漿コルチゾル濃度の 80% を削減することになります。						
IP3K Inhibitor	519178-28-0	443.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）or Methanol（5 mg/ml）	406170-5MG	34,900
[Inositol-1,4,5-trisphosphate 3-Kinase Inhibitor; N^2-（*m*-Trifluorobenzyl）, N^6-（*p*-nitrobenzyl）purine]	細胞透過性の 2,6,- 二置換プリン化合物。IP3K に対する選択的な ATP 競合阻害剤として作用します（IC_{50}= 10.2 μM）。IP3K は、IP3（製品番号 407123 および 407137）の IP4（製品番号 407126）への変換を触媒する酵素です。細胞内 IP3 濃度の上昇および Ca^{2+} 放出の増加を用量依存的に誘導します [5-20 μM（HL60 細胞）]。Cdk1（IC_{50} > 100 μM）ならびに他の 2 種類の IP3 代謝酵素（PLC および IP3 5-ppase）に対しては 200 μM の高濃度でもほとんど作用を示しません。生細胞を用いた研究において、細胞非透過性の IP3 または IP3 アナログに代わる試薬として非常に有用です。						
MAGL Inhibitor III, JZL184	1101854-58-3	520.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO	475741-10MG	23,000
PPARγ Antagonist III, G3335	36099-95-3	333.3	≥97% by elemental analysis	+4℃	H_2O（30 mg/ml）. Addition of a small amount of acid or base may be required for complete solubilization.	516566-50MG	23,900
（H-Trp-Glu-OH）	選択的かつ可逆的な PPARγ アンタゴニストとして作用する細胞透過性ジペプチド（K_d 約 8 μM）。トランスフェクト COS-7 細胞において Rosiglitazone（100 nM）のアゴニスト活性を阻害（IC_{50} = 31.9 μM）することが示されています。						

脂質シグナル伝達

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Pristimerin	1258-84-0	464.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (2.5 mg/ml)	530070-5MG	16,000
細胞透過性のジエノン - フェノール性トリテルペノイド。抗腫瘍作用を示します。IKKα/β および IκB のリン酸化阻害を通じて、キモトリプシン様 20S プロテアソーム活性（EC_{50} < 125 nM）および NF-κB 活性化の二重阻害剤として作用します。原発性黒色腫細胞のアポトーシスを誘導し増殖を停止するとともに（IC_{50} は約 200 nM）、マウス異種移植モデルにおける形質細胞腫を抑制します（2.5 mg/kg、尾静脈内注射）。さらに、bortezomib（多発性骨髄腫治療薬）の細胞傷害性に対する骨髄腫細胞の相乗的化学増感剤となることが判明しています。						
SREBP Processing Inhibitor, Betulin	473-98-3	442.7	≥ 95% by NMR	+4℃	DMSO	569371-250MG	25,000
RXRα Inhibitor, K-80003		350.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	557451-10MG	31,900
K-80003							
他の NSAID とは異なり RXRα 結合の IC_{50}=2.4 μM の細胞透過性スリンダク類似体は 1 mM の時点でも COX2 and COX1 に対して不活性です。この化合物は PC3 ならびに A549 細胞への RXRα 依存性 AKT 活性の有効な阻害性を示しており、PC3 細胞に見られるように RXRγ ではなく RXRα 発現依存です。NF-α の不在・存在に関わらず p85α を持つ RXRα/δ80 の相互作用を阻害することも示されています。TNF-α と共に使用されたとき、50 μM で PARP cleavage ならびにカスパーゼ -8 活性を誘発します。さらに、25 μM *in vitro* で HeLa/RXRα/1-134 ならびに RXRα/δ8 細胞のコロニー形成をほとんど完全に抑制し、60mg/kg 投与されたとき腫瘍増殖 *in vivo* の有効阻害を示します。						
Sphingosine Kinase Inhibitor		339.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	567731-10MG	18,000
[2-(*p*-Hydroxyanilino)-4-(*p*-chlorophenyl) thiazole, HCl; SK Inhibitor]							
抗腫瘍活性を示す細胞透過性の 2 置換チアゾール化合物。強力で、非 ATP 競合的、非常に選択的なスフィンゴシンキナーゼの阻害剤（IC_{50} = 0.5 μM for GST-hSK）。hERK2, hPI3K, PKCα のキナーゼ活性には 60 μM でも影響しません。 スフィンゴシン - 1 リン酸を阻害（IC_{50} 約 1 - 5 μM）することで、薬物移送タンパク質 Pgp、MRP1 を発現するヒトがん細胞にアポトーシスを誘導します。						
T0070907	313516-66-4	277.7	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	575305-5MG	28,000
[2-Chloro-5-nitro-N-(4-pyridyl) benzamide]							
細胞透過性のクロロ - ニトロ - ベンズアミド化合物。PPARγ に対する強力で特異的かつ不可逆的な高親和性アンタゴニストとして作用します（K_i = 1 nM）。PPARγ に対して PPARα（K_i = 0.85 μM）および PPARδ（K_i = 1.8 μM）より 800 倍以上高い選択性を示します。3T3-L1 細胞において、ホルモンおよびアゴニストによって誘導される脂肪生成を抑制します。PPARγ とコアクチベーター由来ペプチドの間の相互作用を抑制すると同時にコリプレッサー由来ペプチドの動員を促進します。コファクタータンパク質のリガンド結合ドメイン内の Cys^{313} に共有結合することによって PPAR γ 2 とコファクタータンパク質との相互作用を調節することが明らかになっています。						

Mitochondrial Function 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Bongkrekic Acid, Triammonium Salt		537.7	≥ 92% by HPLC	-20℃	2N NH_4OH (0.5 mg/ml) or Ethanol (10 mg/ml)	203671-500UG	71,000
(BA, $3NH_4$; 3-Carboxymethyl-17-methoxy-6,18,21-trimethyldocosa-2,4,8,12,18,20-heptaenedioic Acid)	アデニンヌクレオチドトランスロケーターのリガンドとして作用します。本品は、ミトコンドリアのメガチャネル（透過性遷移孔）の強力な阻害剤です。一酸化窒素によって誘導されたアポトーシス徴候を顕著に軽減します。アポトーシスによるミトコンドリア内膜電位($\delta\Psi_m$)の消失およびアポトーシスに関連した他の様々な現象を防止します。						
Carbonyl Cyanide m-Chlorophenylhydrazone	555-60-2	204.6	≥ 95% by GC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Etthanol (1 mg/ml)	215911-250MG	20,900
(CCCP)	プロトノフォア。酸化的リン酸化の脱共役剤でミトコンドリアの機能を阻害します。2,4- ジニトロフェノールより約 100 倍強力な活性を示します。チトクローム c オキシダーゼに高い親和性で結合します（K_d= 270 nM）。輸送過程を阻害し、増殖を抑制します。						
Carboxyatractyloside, Potassium Salt, *Xanthium sibiricum*	35988-42-2	939.1	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (10 mg/ml)	216201-2MG 216201-5MG	32,000 61,000
C-ATR	アデニンヌクレオチドトランスロケーター（ANT）の高度に選択的かつ強力な阻害剤であり（K, <10 nM）、透過性遷移孔の誘導因子でもあります。ANT のヌクレオシド結合部位を内膜の細胞質側に安定化させ、マトリックス ATP と細胞質 ADP の交換を抑制します。ミトコンドリア multiple conductance channel（MCC）の働きには影響を与えません。						
CGP-37157	75450-34-9	324.2	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) . Dilute in Ca^{2+}-free buffer just prior to use.	220005-5MG	33,900
[7-Chloro-5-(2-chlorophenyl)-1,5-dihydro-4,1-benzothiazepin-2(3H)-one]	ミトコンドリア Na^+/Ca^{2+} 交換体（IC_{50} = 360 nM）の特異的で有効な阻害剤として働くクロナゼパムの細胞透過性ベンゾジアゼピン系誘導体。単離ミトコンドリアから Ca^{2+} の放出を増進します。また電位依存性 Ca^{2+} チャネルを直接阻害すると報告されています。						
Etomoxir	828934-41-4	338.76	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	236020-5MG	21,900
	細胞透過性の不可逆的かつ立体特異的な阻害剤。ラット心臓の H9c2 筋原細胞ミトコンドリアにおけるカルニチンパルミトイルトランスフェラーゼ（CPT）-1 および DGAT（ジアシルグリセロールアシルトランスフェラーゼ）活性を、それぞれ濃度 1-80 µM および 40 µM において阻害することが判明しています。						
DGAT-1 Inhibitor, A 922500	959122-11-3	428.48	>95% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml)	252801-5MG	40,900
	同等あるいは低い有効性で、DGAT-2（IC_{50} = 53 µM）と系統発生的ファミリーメンバーのアシルコエンザイム A コレステロールアシルトランスフェラーゼ -1 ならびに -2（IC_{50} = 296 µM）を標的にする可能性を持つ、経口投与可能なヒトならびにマウスのジアシルグリセロールアシルトランスフェラーゼ DGAT-1 阻害剤（IC_{50} = それぞれ 9nM ならびに 22 nM）。*in vivo* 活性は、脂質異常のハムスターに 1 日の投与量 3 mg/kg を経口投与すると、血清トリグリセリド、FFA 濃度、総コレステロールを、ベースラインと比較してそれぞれ 53%、55%、25% 効果的に低減します。ズッカー肥満ラットにおいても、トリグリセリドと FFA 濃度の同様の低減が見られます。						
Hexokinase II VDAC Binding Domain Peptide, Cell-Permeable		3997.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	376816-1MG	50,000
(H-RQIKIWFQNRRMKWKK-MIASHLLAYFFTELN-NH_2; HXK2VBD-cpm)	Hexokinase II VDAC 結合ドメインペプチドの細胞透過性のアナログ。ホメオ box タンパク質アンテナペディアの細胞内侵入ドメインを N 末メチオニンに融合したもの。HeLa 細胞で 100 µM で完全に HXK2 をミトコンドリアから解離移行させます。単独では Bax の移行やチトクローム C 放出には影響しません。しかし、Bax 依存性のアポトーシス誘導剤インドメタシン（製品番号 405268）と併用するとチトクローム C 放出性を上げ、アポトーシスを誘導します。						
m-Iodobenzylguanidine, Hemisulfate	80663-95-2	324.1	≥ 99% by HPLC	+4℃	H_2O (20 mg/ml)	407721-10MG	27,900
(3-Iodobenzylguanidine, Hemisulfate; MIBG)	抗増殖剤ならびに生存促進性を示す細胞透過性ノルエピネフリン類似体。アルギニン依存性単 ADP リボシル化を阻害し、ミトコンドリア呼吸を妨げ、解糖を刺激し、可逆的に骨格筋芽細胞の末端分化を防ぐと報告されています。ノルエピネフリン輸送体（NET）を介して交感神経ニューロンと神経内分泌の新生物が豊富な組織に容易に取り込まれます。MAP と PI3- キナーゼ の刺激における影響のない Rho エフェクター PRK1/2 のリン酸化反応を阻害します。						
LRRK2-IN-1		570.31	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	438193-5MG	33,900
Mitochondrial Division Inhibitor, mdivi-1	338967-87-6	353.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	475856-10MG	21,900
3-(2,4-Dichloro-5-methoxy-phenyl)-2-thioxo-1H-quinazolin-4-one	細胞透過性のキナゾリノン化合物。ダイナミン関連 GTPase（Dnm1/Drp1）を作用標的とし、ミトコンドリア分裂ダイナミンの急速かつ選択的な可逆的アロステリック阻害剤として作用します（酵母 / 哺乳動物細胞における IC_{50}= 約 10 ～ 50 µM）。Bax/Bak 依存性のミトコンドリア外膜透過性（MOMP）を阻害することにより、アポトーシスを減少させることが判明しています。						
Rotenone	83-79-4	394.4	≥ 98% by TLC	room temp.	Chloroform (50 mg/ml) , DMSO (50 mg/ml) , or ethanol (5 mg/ml)	557368-1GM	18,900
	ミトコンドリア毒素。呼吸鎖複合体 I（NADH-CoQ リダクターゼ）の可逆的、競合的かつ強力な阻害剤。また、マウス肝臓内の細胞増殖も阻害します。						
Ru360		550.8	≥ 97% by capillary electrophoresis	-20℃	Deoxygenated H_2O	557440-500UG 557440-1MG 557440-1SET	32,900 55,900 87,000
{(µ)[$(HCO_2)(NH_3)_4Ru]_2OCl_3$}	細胞浸透性の酸素架橋二核ルテニウムアミン複合体。ミトコンドリアに高いアフィニティーで結合することが示されています（K_d= 340 pM）。*in vitro*（IC_{50} = 184 pM）および筋細胞の *in situ* でミトコンドリアへの Ca^{2+} の取込みを遮断します（約 10 µM の Ru360 による 30 分間のインキュベーション後に完全なブロック）。心筋収縮に関与する他の細胞性 Ca^{2+} 輸送プロセスに対しては、マイクロモーラーレベルの濃度でも影響しません。						
Valinomycin, *Streptomyces fulvissimus*	2001-95-8	1111.3	≥ 93% by HPLC	room temp.	Acetic acid, $CHCl_3$, DMSO, or ether	676377-25MG 676377-100MG	13,000 43,500
	シクロデカデプシペプチドイオノフォア抗生物質。人工または生体の脂質膜を横切って、アルカリ金属イオンを輸送する移動性イオンキャリア型カリウムイオノフォア。10^{-8} M ほどの濃度で細胞膜の K^+ 伝導を誘導します。しばしば、K^+ 濃度を測定するための膜電極系で用いられます。膜上のスルフヒドリル基の豊富な部位に結合することにより、酸化的リン酸化を脱共役させます。マウス胸腺細胞でアポトーシスを誘導。また、NGF 誘導性の神経分化を阻害することが報告されています。						

神経科学・神経変性

Amyloidogenesis 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Aβ42 Fibrillogenesis Inhibitor III		678.8	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	171588-5MG	39,900
（Amyloid β_{42} Fibrillogenesis Inhibitor III; Ac-LPFFD-NH_2; iAβ5p）	Aβ$_{42}$ Fibrillogenesis Inhibitor I（製品番号 171586）を修飾したアナログ。血液脳関門を通過し、β シートを破壊する作用を示します。アルツハイマー病のトランスジェニックマウスモデルにおいて神経細胞の生存を促進し、脳の炎症を抑制することが報告されています。この作用は、Aβ沈着の減少によるものと考えられます。タンパク質分解に対して高い安定性を示します［$t_{1/2}$ > 24 hr（ヒト血漿および髄液）、約37 min（血液）］。						
APP β-Secretase Inhibitor		1651.8	≥ 98% by HPLC	-20℃	Aqueous Buffers（pH 7.5）（1 mg/ml）.	171601-500UG	31,000
[KTEETSEVN（stat）VAEF]	アミロイド前駆体タンパク質（APP）β- セクレターゼの強力な阻害剤です（IC_{50} = 30 nM）。						
Clioquinol	130-26-7	305.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（20 mg/ml）, Ethanol（1 mg/ml）or Methanol（1.5 mg/ml）	233165-1GM	13,000
（5-Chloro-7-iodo-8-hydroxyquinoline）	神経毒性を有する抗生物質。老人斑を溶解し、アミロイドの凝集能を低下させることが報告されています。これは、老人斑およびアミロイドの沈着を促進する Cu^{2+} および Zn^{2+} をトラップすることによるものと考えられます。動物モデルにおいて、主に遠位部に存在する軸索変性を促進することが示されています。						

Secretase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
InSolution™ OM99-2	314266-76-7	893	≥ 90% by HPLC	-20℃		496000-250UG	76,000
（EVNL Ψ AAEF）	非常に強力なペプチド擬態型の β- セクレターゼの遷移状態アナログ阻害剤。強固に結合します（組み換えメマプシン 2 の場合は K_i=1.6 nM、組み換えプロメマプシン 2 の場合には K_i=9.58 nM）。 Asp から Ala への置換をもつ Swedish 型 β- アミロイド前駆体タンパク質（APP）の β- セクレターゼ部位を元に設計。また、Leu と Ala の間に非加水分解性のヒドロキシエチレンイソスターも含みます。						
Pepstatin A Methyl Ester		699.9	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	516485-1MG	18,900
（Isovaleryl-V V-Sta-A-Sta-OCH_3; PME）	Pepstatin A の細胞浸透性メチルエステル誘導体。γ- セクレターゼの強力な非競合性遷移状態アナログとして作用します。（可溶化ヒト γ セクレターゼについて K_{is}=15 nM、K_{ii}=32 nM; ただし K_{is} は遊離酵素と結合する阻害物質の阻害定数、K_{ii} は酵素 - 基質複合体と結合する阻害物質の阻害定数。）						
SB 225002		352.1	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	559405-1MG	19,900
[N-（2-Hydroxy-4-nitrophenyl）-N'-（2-bromophenyl）urea]	G タンパク質共役受容体 CXCR2（IL-8RB）の強力かつ選択的なアンタゴニスト（CXCR2 への ^{125}I-IL-8 の結合阻害については IC_{50} = 22 nM）。IL-8 と GROα の両方によって誘導されるヒトおよびウサギ好中球の走化性を *in vitro* で阻害し、また、ウサギにおいて IL-8 が誘導する好中球の走化性を選択的に妨げます。						
β-Secretase Inhibitor II		461.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	565749-1MG 565749-5MG	15,900 56,900
（N-Benzyloxycarbonyl-Val-Leu-leucinal; Z-VLL-CHO）	β- セクレターゼの強力な細胞浸透性可逆的阻害剤。Swedish 変異アミロイド前駆体タンパク質（APP）の β- セクレターゼ切断部位（VNL-DA）に対応しています。野生型 APP751 を安定にトランスフェクトしたチャイニーズハムスター卵巣（CHO）細胞において、$Aβ_{total}$（IC_{50} = 700 nM）と $Aβ_{1-42}$（IC_{50} = 2.5 μM）のどちらの形成も阻害します。						
γ-Secretase Inhibitor I		475.6	≥ 90% by HPLC	-20℃	50% acetic acid or DMSO（10 mg/ml）	565750-1MG	28,000
（Z-LLNle-CHO）	アミロイド前駆体タンパク質（APP）を切断して、β- アミロイドタンパク質を生成するプロテアーゼである γ- セクレターゼを阻害します。この酵素の阻害は、アルツハイマー病の防止を助けると考えられています。						
γ-Secretase Inhibitor II		705.8	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mM）	565755-1MG	45,000
（MW167）	可逆的、選択的なペプチド様 γ- セクレターゼ阻害剤（Aβ の完全な阻害に関し、IC_{50} = 13 μM）。カルパイン II に対して、弱い阻害活性を示します（精製酵素アッセイにおける IC_{50} = 100 μM）。						
γ-Secretase Inhibitor IV		402.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	565761-1MG	27,000
[N-（2-Naphthoyl）-Val-phenylalaninal; 2-Naphthoyl-VF-CHO]	γ- セクレターゼの細胞浸透性で可逆的な阻害剤。アミロイド前駆体タンパク質 Swedish 変異体を安定にトランスフェクトした HEK293 細胞において、$Aβ_{x-40}$（ED_{50} = 2.6 μM）と $Aβ_{x-42}$（ED_{50} = 2.7 μM）の放出を等力的に抑制します。						
γ-Secretase Inhibitor VI		311.1	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（200 mg/ml）	565763-5MG	43,900
[1-(S)-*endo*-N-(1,3,3)-Trimethylbicyclo[2.2.1]hept-2-yl)-4-fluorophenyl Sulfonamide]	Aβ$_{42}$ の生成を強力に阻害します（IC_{50} = 1.8 μM）。Aβ$_{42}$ の阻害は γ- セクレターゼ・タンパク質分解経路を介して生じ、機構に特異的な阻害に矛盾しない APP$_{\alpha}$S 合成の増加を示します。						
γ$_{40}$-Secretase Inhibitor I		418.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	565765-1MG	27,000
(N-*trans*-3,5-Dimethoxycinnamoyl)-Ile-leucinal; t-3,5-DMC-IL-CHO)	$Aβ_{1-40}$ の分泌を優先的に阻害する（$Aβ_{1-40}$ は 90% 以上なのに対し $Aβ_{1-42}$ では約 15%）と思われる強力かつ細胞浸透性な可逆的 γ- セクレターゼ阻害剤。βAPP695 をコードする cDNA を安定にトランスフェクトした CHO 細胞において、$Aβ_{total}$ IC_{50} = 約 15 μM，$Aβ_{1-40}$ IC_{50} = 約 22 μM，$Aβ_{1-42}$ IC_{50} > 50 μM。Z-Val-Phe-CHO（MDL 28170; 製品番号 208722）よりも約 10 倍高い活性をもつと報告されています。						
γ-Secretase Inhibitor IX	208255-80-5	432.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（20 mg/ml）	565770-5MG 565770-10MG	24,900 38,000
{DAPT; N-[N-（3,5-Difluorophenacetyl-L-alanyl）]-S-phenylglycine *t*-Butyl Ester}	細胞透過性のジペプチド。γ- セクレターゼを阻害することによって Aβ 生成を抑制します［IC_{50} = 115 nM（$Aβ_{total}$）、200 nM（$Aβ_{42}$）］。マウス N2a 細胞および hAPP/hBACE-1 導入ヒト HEK293 細胞における $Aβ_{34}$ 生成を抑制します。HEK293 細胞および神経細胞培養においてアミロイド β 前駆体タンパク質（APP）の分泌に影響を与えずに阻害活性を示すことが報告されています。また、APP トランスジェニックマウスにおいて Aβ 濃度を急激に低下させることが明らかになっています。3xTgAD トランスジェニックマウスにおいて細胞外 Aβ 斑および細胞内 Aβ 蓄積を減少させることが報告されています。						
InSolution™ γ-Secretase Inhibitor X		672.9	≥ 90% by HPLC	-20℃		565771-250UG 565771-500UG	59,000 92,900
{L-685,458; {1S-Benzyl-4R-[1-（1S-carbamoyl-2-phenethylcarbamoyl）-1S-3-methylbutylcarbamoyl]-2R-hydroxy-5-phenylpentyl}carbamic Acid *tert*-butyl Ester}	細胞浸透性のヒドロキシエチレンジペプチドイソスター。γ- セクレターゼの非常に特異的かつ強力なインヒビターとして作用します（spβA4CTF を過剰発現している SHSY5Y 細胞において $Aβ_{total}$ IC_{50}=17 nM、Aβ40 IC_{50}=48 nM、Aβ42 IC_{50}=67 nM）。プレセニリン 1 および 2（PS1、PS2）に結合し、神経細胞における Notch 細胞内ドメインの合成を阻害します。アスパルチルプロテアーゼの触媒部位で遷移状態アナログ擬態として機能します。γ- セクレターゼに対してカテプシン D よりも 100 倍以上高い選択性を示します。						
γ-Secretase Inhibitor XI		225.6	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	565772-5MG	28,000
（7-Amino-4-chloro-3-methoxyisocoumarin; JLK6）	細胞透過性を有する活性部位特異的な不可逆的セリンプロテアーゼ阻害剤。イソクマリンのアナログです。強力かつ選択的な γ- セクレターゼ阻害剤として作用します。野生型および Swedish mutant のアミロイド β 前駆体タンパク質（APP）を過剰発現している HEK293 細胞において、アミロイド $β_{40}$（$Aβ_{40}$）と $Aβ_{42}$ の双方の生成を抑制します（IC_{50} < 100 μM）。						

Secretase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
γ-Secretase Inhibitor XII		362.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	565773-5MG	42,000
（Z-IL-CHO）	細胞浸透性の可逆的に働くジペプチドアルデヒド。*in vitro*（Aβ40 IC_{50}=7.9 μM; Aβ42 IC_{50}=7.6 μM）および APP695 を安定に過剰発現する培養 CHO 2b-7 細胞（Aβ40 IC_{50}=11.5 μM; Aβ42 IC_{50}=8.3 μM）において、γ- セクレターゼを阻害することにより Aβ 産生を抑制します。また、CTFγ（γ- セクレターゼから生じる C 末端フラグメント）の生成を阻害します。アミロイド -β 前駆体タンパク質の形成には影響しません。						
γ-Secretase Inhibitor XVI		390.4	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（2 mg/ml）	565777-5MG	26,900
（DAPM; N-[N-3,5-Difluorophenacetyl]-L-alanyl-S-phenylglycine Methyl Ester）	抗凝固性を示す細胞浸透性 γ セクレターゼ阻害物質（7PA2 細胞における Aβ 生成についての IC_{50} は約 10 nM）。Aβ 二量体および三量体形成を選択的に阻害することにより、Aβ の早期オリゴマー化を抑制します。						
β-Secretase Inhibitor III		963.1	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（1 mg/ml）	565780-500UG	25,000
（H-EVNstatineVAEF-NH_2; Inhibitor GL189）	β- セクレターゼ（BACE）の基質アナログ阻害剤。BACE 形質転換 MDCK 細胞に由来する可溶化膜分画のタンパク質分解活性を（5 μM で）完全に阻害します。						
InSolution™ γ-Secretase Inhibitor IX		432.5	≥ 95% by HPLC	+4℃		565784-5MG	22,000
{DAPT; N-[N-（3,5-Difluorophenacetyl-L-alanyl）]-S-phenylglycine *t*-Butyl Ester}	DMSO に γ- セクレターゼ阻害剤 IX（製品番号 565770）の 25 mM（5 mg/462 μl）溶液。						
β-Secretase Inhibitor IV		578.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（200 mg/ml）or Methanol（100 mg/ml）	565788-1MG	40,000
	細胞透過性のイソフタルアミド化合物。BACE-1 活性部位に結合するヒドロキシエチルアミンモチーフをもち、BACE-1 のタンパク質分解活性を強力に阻害します [IC_{50}=15 nM（ヒト BACE-1）、29 nM（HEK293-APPNFEV 細胞の sAPP_NF）]。BACE-1 に対して他のアスパラギン酸プロテアーゼより高い選択性を示します [IC_{50}=0.23 μM（BACE-2）、7.6 μM（カテプシン D）、> 50 μM（レニン）]。						
γ-Secretase Inhibitor XX		463.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	565789-500UG	40,000
{DBZ; Dibenzazepine;（S,S）-2-[2-（3,5-Difluorophenyl）acetylamino]-N-（5-methyl-6-oxo-6,7-dihydro-5H-dibenzo[b,d]azepin-7-yl）propionamide}	細胞透過性のジベンズアゼピン（dbz）化合物。強力な γ セクレターゼ阻害剤として作用し、Tg2576 変異型 APP トランスジェニックマウスモデルにおいて脳および血漿の両 $Aβ_{40}$ レベルを有意に約 72% ほど低下させます（100 μmol/kg を 1 日 2 回）。また、Notch のプロセッシングを強力に阻害し（SupT1 細胞における IC_{50}=1.7 nM）、増殖性の陰窩細胞から分裂の終了した細胞への変換を C57BL/6 と *Apc*^{Min} の両マウスモデルにおいて誘導します（10 μmol/kg、腹腔内投与）。						
γ-Secretase Inhibitor XXI		490.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	565790-500UG	53,000
{Compound E;（S,S）- 2-[2-（3,5-Difluorophenyl）-acetylamino]-N-（1-methyl-2-oxo-5-phenyl-2,3-dihydro-1H-benzo[e][1,4]diazepin-3-yl）-propionamide}	細胞透過性のペプチドミメティック非遷移状態アナログ。γ セレクターゼおよび Notch プロセッシングの強力かつ選択的な阻害剤として作用します（野生型 βAPP を過剰発現している CHO 細胞において、$Aβ_{40}$ に対する IC_{50}=300 pM；$βAPP_{695}$ と mNotchDE（M1727V）を安定にトランスフェクトした HEK293 細胞では $Aβ_{40}$ に対して 240 pM、$Aβ_{42}$ に対して 370 pM、NICD に対して 320 pM；SPA4CT を安定にトランスフェクトした SH-SY5Y 細胞では $Aβ_{40}$ と $Aβ_{42}$ の両方に対して 100 pM）。いくつかの APP トランスジェニックマウスモデルにおいて Aβ レベルを低下させます。また、プレセニリンに結合し、APLP1 および APLP2、CD44、ErbB4、E- カドヘリン、低密度リポタンパク質受容体関連タンパク質、Notch リガンドおよび $p75^{NTR}$ を含む膜貫通タンパク質基質のタンパク質分解性切断を抑制することが報告されています。プレセニリナーゼ活性には非常に高い濃度（200 - 400 μM）でも弱い影響しか与えません。						
γ-Secretase Inhibitor XXI, Compound E	209986-17-4	490.5	≥ 95% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	565790-1MG	71,000
γ-Secretase Inhibitor XXII , Ab42-Selective, CS-1	1210283-33-2	466.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	565791-10MG	18,000
3,3′-（3,4,5-Trifluorophenyl）methylenebis-（4-hydroxycoumarin）	アロステリックな非基質競合機構を通じてプレセニリン基質結合部位内の S1′ ならびに S3′ ポケットに警告を発することで、無細胞 APP の cleavage アッセイ（IC_{50}= 0.07、0.71、0.31、and 1.77 μM、respectively）とヒト・ネズミ培養（100% blockage of Aβ42 production and no effect against the rest at 30 μM）における Aβ38、Aβ40、Notch1 に対する Aβ42 の γ-secretase 介在生成を選択的に阻害する細胞透過性の di-coumarin 化合物。						
γ-Secretase Inhibitor XXIV, BMS299897	290315-45-6	511.9	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	565793-5MG	33,000

神経科学・神経変性

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Formyl Peptide Receptor-Like 1 Antagonist, WRW4		1104.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	344220-5MG	53,900
（FPRL1 Antagonist, WRW^4; H_2N-WRWWWW-$CONH_2$）	Formyl Peptide Receptor-Like 1（FPRL1）を介したシグナル伝達を強力かつ特異的に阻害する、Trp リッチなヘキサペプチドです。FPRL1 に結合してリガンド - 受容体相互作用を阻害することが明らかになっています [FPRL1 Agonist, WKYMVm（製品番号 344216）に対する IC_{50} = 230 nM]。10 µM の濃度で、リガンド活性化 [Ca^{2+}] 上昇、ERK 活性化、および FPRL1 発現 RBL-2H3 細胞の走化性移動を完全に抑制します。また、Aβ42 ペプチド誘導性のスーパーオキシド生成を阻害し、ヒトマクロファージへの内在化を抑制します。 Supplied as a trifluoroacetate salt.						
Galanthamine, Hydrobromide	69353-21-5	368.3	＞ 97% by TLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）, Ethanol（1 mg/ml）or H_2O（1 mg/ml）	345670-20MG	22,000
（Nivalin, HBr）	競合的、可逆的なアセチルコリンエステラーゼ阻害剤。抗痴呆剤。ラットでスコポラミンで誘導した記憶障害を部分的に改善します。動物実験で学習能力と短期記憶能力を改善することが報告されています。						
Notch Transcription Factor Inhibitor, SAHM1		3228.9	≥ 93% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）	491002-1MG	36,900
AcβA1a-ERLRRRI*LCR*HHST（*=S5）	重要なタンパク質間インターフェイスを標的とし、NOTCH1 転写促進複合体においてアセンブリを防ぐ細胞透過性、安定的な炭化水素結合の α- ヘリックスペプチド。水溶性 FITC-SAHM1 は、MAML1 と競合的に、あらかじめ形成された RAMANK-CSL 複合体（K_d = 0.12 µM）と結合する一方、未修飾の FITC-MAML1（21-36）ペプチドは *in vitro* プルダウンアッセイにおいて著しく親和性が減退した複合体を結合しました。化合物 20 µM の KOPT-K1 細胞株の処理は NOTCH1 標的遺伝子、HES4、DTX1、HES1 の抑制をもたらします。この化合物による NOTCH1 活性か遺伝子発現への継続的な抑制作用は様々な突然変異体 NOTCH1 対立遺伝子を含むヒト T-ALL 細胞株のパネル全体を通して見られました。β- ラクタメーゼ（IC_{50} < 2.5 µM）と同様に、HeLa 細胞においては、また、このペプチドはルシファラーゼレポーター遺伝子アッセイにおいて用量依存的に ICN1（IC_{50} = 6.56 µM）の発現を阻害しました。さらに、このペプチドの処理は、15 µM 時の培養細胞ならびに 1 日 2 回 30 mg/kg で T-ALL 細胞のマウスモデルにおける NOTCH 介在増殖を阻害します。						
PICK1 PDZ Domain Inhibitor FSC231		313.1	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	529531-10MG	33,000
Prionogenesis inhibitor, DAPH-12	145915-63-5	389.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（100 mg/ml）	530007-10MG	20,000
Aβ42 Amyloidogenesis Inhibitor	*de novo* 線維化のプロセスをブロッキングし事前に形成された NM 線維を分解することで、酵母 Sup35N- 末端ドメイン -（aa 1 -124; NM）介在 prionogenesis と同様に、Aβ4 アミロイド形成を中和する細胞透過性 4,5- ジアニリノフタルイミド。DAPH-12 による処理は、プリオンを持つ酵母集団（[*PSI*$^+$]）と持たない酵母集団（[*psi*$^-$]）の割合を著しく減らします。DAPH-12 はまた、[*RNQ*$^+$] プリオンを含む細胞に対して全く活性がない一方、用量依存的に [*PSI*$^+$] phenotype を効果的に [*psi*$^-$] に変換することが示されています。DAPH-12 は通常、無細胞と細胞ベースシステムの両方で NM プリオンの様々な形を中和することにおいて EGCG（製品番号 324880）より効果的ですが、これらタンデムに使用された二つの試薬は抗プリオン活性に対して相乗効果を生み出すことができます。						
Quinacrine, Dihydrochloride	69-05-6	472.9	≥ 98% by HPLC	room temp.	H_2O	551850-100MG	10,000
（Mepacrine）	非特異的フォスフォリパーゼ A_2（PLA_2）阻害剤。アセチルコリン受容体のアンタゴニストとして作用します。グリベンクラミド感受性 K^+ 電流を抑制します（IC_{50} = 4.4 µM）。モノアミンオキシダーゼ（MAO）も阻害します。						
Tau Aggregation Inhibitor, ATPZ, Cpd16		360.82	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）	580222-10MG	30,000
5-amino-3-（4-chlorophenyl）-N-cyclopropyl-4-oxo-3,4-dihydrothieno[3,4-d]pyridazine-1-carboxamide	ヘパリン誘発性タウアセンブリアッセイ（チオフラビン T 結合ならびに蛍光モニター）における IC_{50} of 8.1 µM を示し、さらに沈降アッセイにおいてタウ線維形成（タウフラグメント K18PL、完全長タウ 40）を >50% 削減することが *in vitro* 確認された水溶性（水分中 32 µM）BBB- 透過性 ATPZ（アミノチエノピリダジン）タウ凝集阻害剤。また、経口バイオアベイラビリティならびに代謝敵安定性の良いマウス完全 PK 研究のいて非常に良い B/P 率（1.6）を示しています。HEK-293 細胞において最大 100 µM で細胞毒性は確認されませんでした。						
Transglutaminase 2 Inhib Neg Control, Zc			≥ 99% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	616468-5MG	19,000
WRN Helicase Inhibitor, NSC 19630	72835-26-8	183.2	≥ 97% by NMR	+4℃	DMSO or EtOH	681647-5MG	22,000

NF-κB 活性 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
5HPP-33		323.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	100066-25MG	37,000
[5-Hydroxy-(2,6-diisopropylphenyl)-1H-isoindole-1,3-dione]	細胞透過性の N- フェニルフタルイミド化合物。TNF-α 産生および NF-κB 活性化を抑制します（IC_{50} = 約 530 nM [HeLa 細胞]）。微小管を標的とし、細胞周期を停止させ、各種 Paclitaxel 耐性腫瘍細胞においてアポトーシスを誘導する（IC_{50} = 約 5 μM）ことが報告されています。細胞分裂阻害作用、増殖阻害作用および抗炎症作用を示します。						
Andrographolide	5508-58-7	350.5	≥ 95% by TLC	+4℃	DMSO (15 mg/ml) or Chloroform:Methanol (1:1) (10 mg/ml). Use only fresh DMSO.	172060-50MG	15,900
(Andro)	抗ウイルス性、抗炎症性、抗アポトーシス性および抗高血糖性を示す二環状ジテルペノイドラクトン。NF-κB および AP-1（IC_{50} ≤ 15 μM）活性化の不可逆的アンタゴニストとして作用し、*in vitro* および *in vivo* で T 細胞活性化を妨げます。IκBα 分解、p50 および p65 の核移行には影響を与えません。iNOS および Mac-1 の発現ならびに ROS 合成を阻害し、マウスモデルにおいて内毒素ショックを妨げます。さらに、PI3K/Akt 経路を活性化することが報告されています。						
Aurothiomalate	12244-57-4	368.1	≥ 98% (Gold content)	+4℃	H_2O (10 mg/ml)	189401-50MG	23,000
(ATM Aurothiomalate, Sodium Salt; AuTM)	金（I）化合物。IKK の活性を阻害し（ID_{50} = 10.9 μM）、IKK の触媒ドメイン内および PKCι の PB1（Phox and Bem1p）ドメイン内のシステイン残基を修飾することによって Par6 と PKCi の間の PB1 ドメインを介した相互作用を阻害します（IC_{50} 約 1 μM）。A549 細胞において PKCι に依存した Rac1 活性化を阻害します。						
InSolution™ BAY 11-7082		207.2	≥ 95% by HPLC	+4℃		196871-10MG	19,900
	DMSO に BAY 11-7082（製品番号 196870）の入った 100 mM（10 mg/483 μl）溶液として提供します。						
CAPE	104594-70-9	284.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (200 mg/ml) and Ethanol (50 mg/ml)	211200-25MG	27,900
(Caffeic Acid Phenethyl Ester, Synthetic)	ミツバチの巣から単離されたプロポリスの活性成分。抗ウイルス作用、抗炎症作用、および免疫調節作用を有することが知られています。HIV-1 インテグラーゼ活性を阻害します。様々ながん化細胞の増殖を阻害します。脂質過酸化を抑制することが報告されています。オルニチンデカルボキシラーゼ、タンパク質チロシンキナーゼ（PTK）、およびリポキシゲナーゼの活性を阻害します。また、様々なオンコジーンによって形質転換されたクローン化ラット胚線維芽細胞（CREF）において、アポトーシスを誘導します。最近、NF-κB 活性化を強力かつ特異的に阻害することも明らかになりました。						
Gliotoxin, *Gladiocladium fimbriatum*	67-99-2	326.4	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Ethanol (2 mg/ml)	371715-1MG	23,000
[2,3,5a,6-Tetrahydro-6-hydroxy-3(hyroxymethyl)-2-methyl-10H-3a,10a-epidithio-pyrazinol[1,2α]indole-1,4-dione]	数種類の病原性菌類より産生される免疫抑制性二次代謝物。膜のチオール基を遮断することにより免疫抑制作用を示します。マクロファージ、胸腺細胞といった多様な種類の細胞に対して、アポトーシス性細胞死を引き起こします。ファルネシルトランスフェラーゼ（FTase）の阻害剤です（IC_{50} = 1.1 μM）。報告によると、リアノジン Ca^{2+} チャネル活性の亢進作用は、リアノジン受容体上にあるシステイン残基の酸化によると思われます。nM 単位の濃度において、B 細胞および T 細胞の NF-κB 活性を特異的に阻害します。						
Hypoestoxide, *Hypoestes rosea*		376.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (3 mg/ml) (slight warming may be required) or Ethanol (5 mg/ml)	401006-1MG	42,900
	抗炎症特性を示す天然細胞浸透性ジテルペン。TNF-α 刺激 HeLa 細胞に対して IκB キナーゼの選択的阻害剤として直接作用（IC_{50} = 24 μM）して NF-κB の活性化を阻害します。IL-1β あるいは IL-17 の刺激による正常ヒト軟骨細胞による一酸化窒素の生成も阻害します。プロスタグランジン合成への影響も、JNK および p38MAPK 活性の阻害も報告されていません。						
IKK Inhibitor II, Wedelolactone	65646-68-6	314.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Methanol (1 mg/ml)	401474-1MG	22,900
(7-Methoxy-5,11,12-trihydroxy-coumestan; Wedelolactone, *Eclipta alba*)	薬用植物 *Eclipta alba* から単離された天然活性成分。IKKα および β のキナーゼ活性を選択的かつ不可逆的に阻害します（IC_{50} < 10 μM）。IκBα のリン酸化および分解を阻害することによって、細胞内での NF-κB を介した遺伝子転写を抑制します。p38 MAP キナーゼおよび Akt には作用を示しません。						
IκB Kinase Inhibitor Peptide, Cell-Permeable		3158.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	PBS, pH 7.4 (1 mg/ml)	401477-1MG	50,000
(Ac-AAVALLPAVLLALLAPDDRHDSGLDSMKDE-NH_2)	活性 IκB のリン酸化部位認識サイトに相当する 14 アミノ酸ペプチドを、FGF（fibroblast growth factor）のシグナルペプチドに融合し細胞透過性にしたものです。 LPS 刺激による IκB kinases（IKK）による IκB の分解を特異的に阻害（RAW 264.7 細胞で < 50 μg/ml）し、NF-κB の活性化を妨げます。						
IκB Kinase Inactive Control Peptide, Cell-Permeable		3126.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	401478-1MG	51,000
(Ac-AAVALLPAVLLALLAPDDRHDAGLDAMKDE-NH_2)	IκB キナーゼ阻害ペプチド（製品番号 401477）の活性のないネガティブコントロール。IκB の認識部位 14 アミノ酸の変異体（Ser^{32} → Ala and Ser^{36} → Ala）を FGF（fibroblast growth factor）のシグナルペプチドに融合し細胞透過性にしたものです。 RAW 264.7 細胞で 50 μg/ml において阻害活性を示しません。						
IKK-2 Inhibitor, SC-514		224.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml)	401479-1MG	22,900
(SC-514)	抗炎症作用を示す細胞透過性の（チエノチエニル）アミノ - アセトアミド化合物。IKK-2 に対する強力かつ可逆的で選択性の高い ATP 競合阻害剤として作用します [IC_{50} 約 3 - 12 μM（IKK-2 ホモダイマー、IKK-1/IKK-2 ヘテロダイマー、および IKK-2）]。本品の特異性は、IKK アイソフォーム（IKK-1、IKK-i）および TBK-1 を含む 31 種類のキナーゼのパネルテストによって確認されています（IC_{50} > 200 μM）。刺激した滑膜繊維芽細胞 RASF において、NF-κB 依存性遺伝子発現を特異的に阻害し、MAP キナーゼ経路は阻害しません。						
IKK Inhibitor III, BMS-345541		255.3	≥ 96% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml)	401480-1MG	42,000
[4-(2'-Aminoethyl)amino-1,8-dimethylimidazo[1,2-a]quinoxaline]	抗炎症作用を示す細胞透過性のキノキサリン化合物。IKK-2 の強力かつ選択的なアロステリック部位結合阻害剤として作用し（IC_{50} 約 0.3 μM）、IKK-1（IC_{50} 約 4.0 μM）より約 10 倍高い選択性を示します。IKKε ならびに 15 種類以上の他のプロテインキナーゼに対しては、100 μM の高濃度でも作用を示しません。IκBα の細胞内リン酸化を阻害し [IC_{50} = 4 μM（THP-1 細胞）]、*in vitro* [IC_{50} = 1-5 μM（THP-1 細胞）] と *in vivo* [IC_{50} = 10 mg/kg（マウス）] の双方において LPS で誘導したサイトカイン産生を阻害します。マウス関節炎モデルにおいて、炎症および関節破壊を効果的に抑制します。						
IKK-2 Inhibitor IV	507475-17-4	279.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	401481-500UG	23,900
{[5-(*p*-Fluorophenyl)-2-ureido]thiophene-3-carboxamide}	細胞透過性のウレイド - カルボキシアミド - チオフェン化合物。IKK-2 の強力な阻害剤として作用し（IC_{50} = 18 nM）、IKK-1、JNK および p38 MAPK より高い選択性を示します。ヒト単球における TNF-α 産生を阻害し（IC_{50} = 0.15 - 2.5 μM）、滑膜線維芽細胞による IL-8 および IL-6 の産生を抑制します（IC_{50} = 0.1 μM）。ラット関節炎モデルにおける足浮腫を強力に抑制します（30 mg/kg の用量でほぼ 100% 抑制）。						
IKK-2 Inhibitor V	978-62-1	383.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (5 mg/ml) or Ethanol (1 mg/ml)	401482-5MG	45,900
[N-(3,5-Bis-trifluoromethylphenyl)-5-chloro-2-hydroxybenzamide; IMD-0354]	細胞透過性のサリチルアミド化合物。IkBα リン酸化を選択的に抑制する（IC_{50} 約 250 nM）ことによって IKK-2 阻害剤として作用し、NF-κB p65 核移行の誘導を抑制します。心筋細胞における IL-1β および MCP-1 の産生を抑制する（IC_{50} < 1 μM）ことによって心保護作用を示し、アディポネクチン放出を制御することによって KKAy マウスのインスリン耐性を改善することが明らかになっています。						

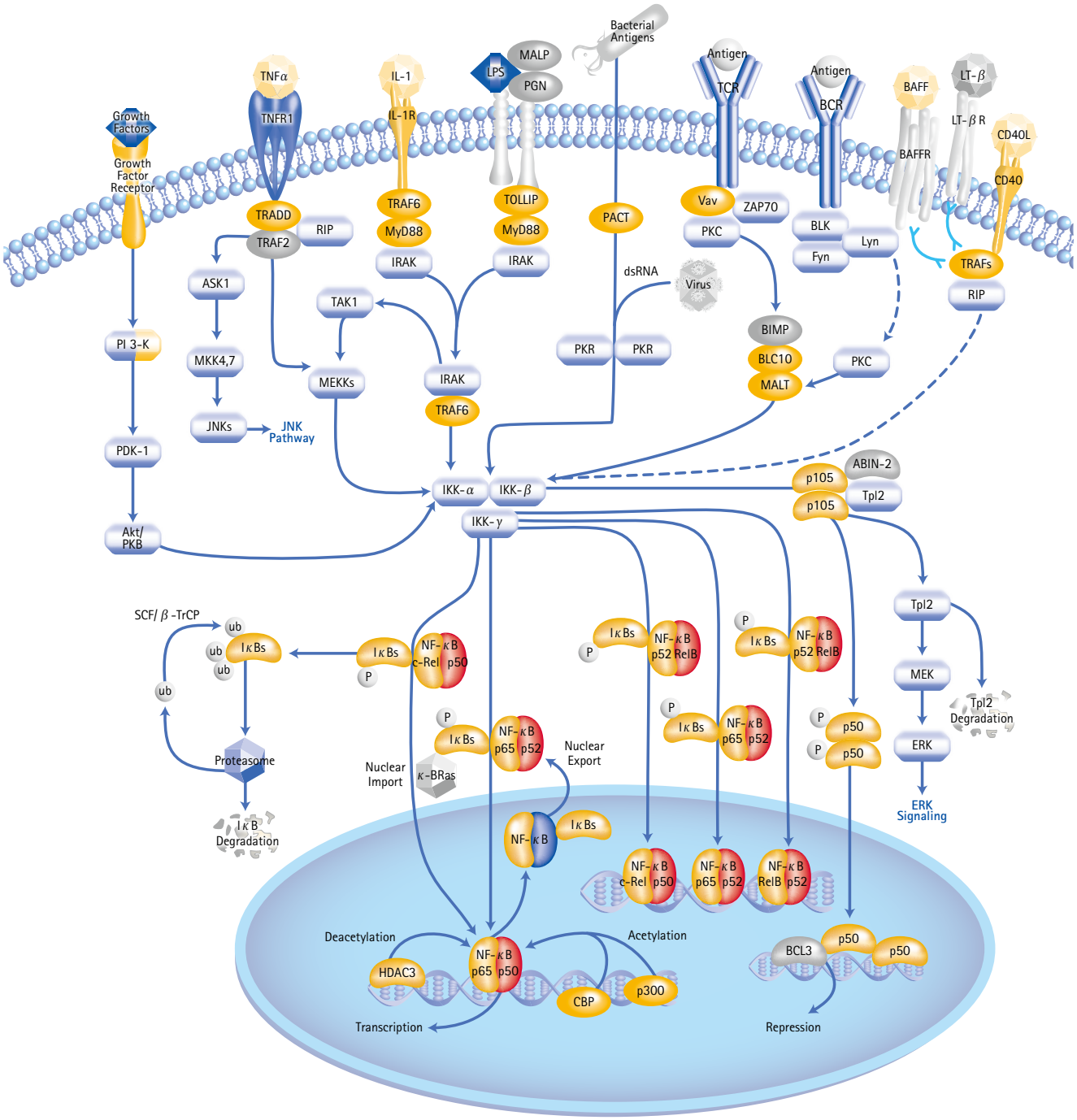
NF-κB 活性 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
IKK-2 Inhibitor VI		261.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	401483-1MG	34,900
[(5-Phenyl-2-ureido) thiophene-3-carboxamide]	ウレイド - チオフェンカルボキサミド化合物。IKK-2 の強力な阻害剤として作用します（IC_{50} = 13 nM）。						
InSolution™ IKK-2 Inhibitor IV		279.3	≥ 95% by HPLC	+4℃		401484-500UG	24,900
	DMSO に溶解した形で供給される IKK-2 Inhibitor IV（製品番号 401481）。細胞透過性のウレイドカルボキサミドチオフェン化合物です。IKK-2 の強力かつ選択的な阻害剤として作用し（IC_{50}=18 nM）、IKK-1、JNK および p38 MAPK には効果を示しません。ヒト単球における TNF- の生産を阻害し（IC_{50} は 0.15 ～ 2.5 M の範囲）、滑液繊維芽細胞による IL-8 および IL-6 の生産をブロックします（IC_{50}=100 nM）。さらに、ラット関節炎モデルにおいて足の浮腫を減少させます（30 mg/kg の用量で約 100% の抑制）。						
InSolution™ IKK-2 Inhibitor, SC-514		224.3	≥ 95% by HPLC	+4℃		401485-1MG	22,900
	IKK-2 Inhibitor, SC-514（製品番号 401479）の 25 mM（1 mg/178 l）DMSO 溶液です。						
IKK Inhibitor VII		483.6	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	401486-1MG	33,900
	IKK の強力かつ選択的な ATP 競合阻害剤として作用する細胞透過性ベンズアミド - ピリジン化合物（IKK-2, IKK 複合体及び IKK-1 に対してそれぞれ IC_{50} = 40 nM, 70 nM, 200 nM）。HUVEC 細胞において IB の分解と、NF-B を介した遺伝子発現を阻害します。マウスとラットにおいて、*in vivo* で効果を発揮します。						
IKK-2 Inhibitor VIII		364.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）. Sonication is required for complete solubilization.	401487-1MG	36,900
[ACHP; 2-Amino-6-(2-(cyclopropylmethoxy) -6-hydroxyphenyl) -4-(4-piperidinyl) -3-pyridinecarbonitrile]	細胞透過性のピペリジニルピリジン化合物。IKK-2 活性の選択的阻害剤として作用し（IKK-2 および IKK-1 に対して、それぞれ IC_{50}=8.5 および 250 nM）、IKK-3、Syk および MKK4 に対しては、ほとんど影響を示しません（IC_{50} > 20 M）。優れた水溶性を示し（pH 7.4 の等張性バッファー中で 0.12 mg/ml）、さまざまな *in vitro* 細胞アッセイにおいて強力な活性を示します（IC_{50} < 150 nM）。ラットとマウスの両方で経口的に利用可能であり（それぞれ BA=60% および 16%）、マウス *in vivo* 耳浮腫モデルにおいてアラキドン酸が誘導する腫脹を効果的に阻害することが示されています。						
IKK-3 Inhibitor IX		469.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	401488-5MG	46,000
[5-(5,6-Dimethoxybenzimidazol-1-yl) -3-(2-methanesulfonyl-benzyloxy) -thiophene-2-carbonitrile]	チオフェンカルボニトオリル化合物。IKK-3 の強力な ATP 競合阻害剤として作用し、IKK-1 および IKK-2 より非常に高い選択性を示します（pIC_{50} = -log10 IC_{50} = 7.4 [IKK-3]、6.1 [Plk1]、< 5.3 [Alk-5]、< 5.0 [EGFR]、< 5.0 [ErbB2]、< 4.8 [GSK-3, IKK-1, IKK-2, JNK-3, p38、p38]）。水溶性を示し（60 M）、チトクローム P450 イソ酵素に対して不活性であることが示されています（pIC_{50} < 4.3）。						
IKK Inhibitor X		322.8	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	401489-5MG	59,000
[N-(6-Chloro-9H-β-carbolin-8-yl) nicotinamide]	抗炎症作用を示す細胞透過性の - カルボリン化合物です。IKK の強力な ATP 競合可逆的阻害剤として作用し（IC_{50} = 約 100 nM [IKK ELISA リン酸化アッセイ]、約 150 nM [TNF- 誘導 HeLa 細胞]）、NF-B 誘導キナーゼ（IC_{50} > 100 M）などの他の 14 種類のキナーゼより高い選択性を示します。刺激した HeLa 細胞における IkB リン酸化および NF-B 活性化を EC_{50} = 5 M で阻害し、LPS チャレンジマウスにおける TNF- 放出を抑制します。						
IKK-2 Inhibitor XI	354810-80-3	261.3	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	401490-5MG	43,900
(5-Phenyl-3-ureido) -thiophene-2-carboxamide	細胞透過性のチオフェンカルボキサミド - ウレイド化合物。IKK-2 の ATP 結合ポケット標的阻害剤として作用するが（IC_{50} = 25 nM）、IKK-1 および JNK1 には、はるかに高い濃度でしか作用しません（それぞれ IC_{50} = 1.0 および 1.6 M）。PBMC では LPS による TNF- の産生を低減し（IC_{50} = 250 nM）、ラットへの経口投与では、優れた薬物動態を示すことが認められています。						
IKK Inhibitor XII	928655-63-4	401.9	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	401491-5MG	32,900
	細胞透過性のアミノジアリルベンズアミド化合物。IKK-1 および IKK-2 に対し ATP 結合部位を標的とする強力な阻害剤として作用しますが（それぞれ pIC_{50} = 6.4 および 7.0）、IKK-3（pIC_{50} <4.8）、ALK5、Cdk-2、EGFR、ErbB2、GSK-3b、Plk1、Src、および VEGFR-2 など他の 50 種類以上のキナーゼパネルに対する阻害活性ははるかに弱く、1/50 未満です。LPS 刺激によるヒト PBMC よりの TNF-、IL-1、および IL-6 の分泌（それぞれ pIC_{50} = 6.1、6.4、および 5.7）、ならびにヒト肺線維芽細胞における TNF- の誘導による NF-B の核移行（pIC_{50} = 5.7）を効果的に抑制することが判明しています。						
IKK Inhibitor XIII, 17-AJB		388.45	>95% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）	401493-1MG	17,000
	細胞透過性の薬草由来ジョルキノライド。IKK- 活性の不可逆的阻害剤として作用します（IC_{50} = 300 nM）。17-AJB は濃度 10 M において、HepG2 培養における TNF- 誘導性の IB- リン酸化 / 分解および NF-B 転写活性とともに、A549 細胞における NF-B p65 の核移行を完全抑制することが判明しています。U937、Jurkat、および CoLo205 などの腫瘍細胞株数種の増殖を抑制するとの報告があります（I_{csub} > 50 はそれぞれ 0.74、1.06、および 2.34 M）。						
Isohelenin, *Inula sp.*		232.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）or Ethanol（20 mg/ml）	416157-1MG	49,000
(Isoalantolactone)	細胞透過性のセスキテルペンラクトン化合物で、抗炎症作用をもちます。非常に特異的で強力な非可逆的 NF-B 活性化阻害剤で IB 分解を阻害することで作用します。活性化 NFB の DNA への結合は阻害しません。 P59^{fyn} や Src キナーゼ活性も阻害しません。 培養ヒト呼吸器上皮細胞における IL-8 遺伝子発現を *in vitro* で阻害し、また培養ラット大動脈平滑筋における iNOS 遺伝子発現を阻害します。また *in vivo* においてエンドトキシンショックから保護する作用が知られています。						
NEMO-Binding Domain Binding Peptide, Cell-Permeable		3693.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）. Note: This peptide will precipitate when added to tissue culture medium even at 100 M concentrations. However, sufficient material will stay in the medium to permeate cells.	480025-500UG	45,900
(DRQIKIWFQNRRMKWKKTALDWSWLQTE; NBD-Binding Peptide, Cell Permeable)	サイトカイン誘導性の NF-B 活性化と NF-B 依存的な遺伝子発現を阻害することによって、消炎作用を示す細胞浸透性のアンテナペディア -NBD（野生型）融合ペプチド。NEMO と IKK（IB）キナーゼ複合体の相互作用をブロックすると提案されています。c-Jun の TNF- 誘導性リン酸化および転写因子 Oct-1 の DNA 結合には影響しません。						
NEMO-Binding Domain Binding Peptide, Cell-Permeable, Negative Control		3463	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）. Note: This peptide will precipitate when added to tissue culture medium even at 100 M concentrations; however, sufficient material will stay in solution to permeate cells.	480030-500UG	45,000
(DRQIKIWFQNRRMKWKK-TALDASALQTE; NBD-Binding Peptide, Cell-Permeable, Negative Control)	細胞浸透性の NEMO-Binding Domain Binding Peptide（製品番号 480025）類似体で、アンテナペディア -NBD 融合ペプチドに変異を加えたもの（Trp^{739} および Trp^{741} を Ala で置換）。NEMO への結合能を欠くことが示されており、ネガティブコントロールとして働きます。c-Jun の TNF- 誘導性リン酸化および転写因子 Oct-1 の DNA 結合には影響しません。						
NF-B Activation Inhibitor VII, CID-2858522			>95% by HPLC	-20℃		480457-10MG	29,900
CID-2858522	他の NF-B 活性経路を阻害することなく、PKC のダウンストリームだが IKK のアップストリームの操作により、HEK293 細胞ベースの NF-B ルシフェラーゼレポーター遺伝子アッセイにおける PMA（IC_{50} = 70 nM）のような PKC 経路活性因子によって誘発された NF-B 活性の細胞透過性選択的阻害剤。10 M のとき、この化合物は 353 プロテインキナーゼのパネルの中で、Raf ならびに TLK1、JAK2 のみに対し、それぞれ 57%、70%、53% 阻害します。Jurkat T- 細胞（IC_{50} < 5 M）とマウス B- リンパ球（IC_{50} = 2 M）の抗 IgM 刺激性細胞増殖による CD3/CD28 と IL-2 の PMA ／イオノマイシン誘発の生成を軽減します。						
NF-B Activation Inhibitor	545380-34-5	356.4	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（5 mg/ml）	481406-1MG	22,900
[6-Amino-4-(4-phenoxyphenylethylamino) quinazoline]	NF-B 転写活性化（Jurkat における IC_{50} = 11 nM）および LPS 誘導性 TNF- 生産（マウス脾細胞における IC_{50} = 7 nM）の強力な阻害剤として働く細胞膜透過性のキナゾリン化合物。ラットのカラゲニン誘導性足浮腫に対して抗炎症効果を示すことが報告されています。						

NF-κB 活性 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
InSolution™ NF-κB Activation Inhibitor		356.4	≥ 98% by HPLC	+4℃		481407-1MG	22,900
	NF-κB Activation Inhibitor（製品番号 481406）の 10 mM（1 mg/281 µl）DMSO 溶液です。						
NF-κB Activation Inhibitor II, JSH-23		240.3	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）	481408-5MG	33,900
[4-Methyl-N¹-(3-phenylpropyl)benzene-1,2-diamine]	細胞透過性のジアミノ化合物。IkB の分解に影響を及ぼすことなく、NF-κB p65 の核内移行とその転写活性を選択的に阻害します（RAW 264.7 を用いた NF-κB レポーターアッセイの IC_{50}=7.1 µM）。NF-κB の DNA 結合を抑制し、LPS が誘導する遺伝子発現とアポトーシス性クロマチン凝集をダウンレギュレートすることが示されています。						
NF-κB Activation Inhibitor III	380623-76-7	328.7	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	481411-5MG	33,900
[3-Chloro-4-nitro-N-(5-nitro-2-thiazolyl)-benzamide; SM-7368]	細胞透過性のチアゾロアミド化合物。HT1080 細胞において、TNF-α 刺激による NF-κB 活性化およびそれに伴う MMP-9 のアップレギュレーションを阻害します（10 µM で完全阻害）。また、MMP-9 アップレギュレーションの阻害に伴い、TNF-α 依存性の細胞浸潤の阻害も引き起こします。TNF-α 誘導性の AP-1 活性には影響を与えず、細胞内標的は p38 活性化の下流にあると考えられます。						
NF-κB Activation Inhibitor IV		228.1	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（20 mg/ml）	481412-10MG	33,900
[(E)-2-Fluoro-4′-methoxystilbene]	細胞透過性のトランススチルベン Resveratrol（製品番号 554325）アナログ。Resveratrol よりはるかに強い抗炎症効果を示しますが、抗酸化活性は示しません。BV-2 細胞において LPS が誘導する COX-2 の mRNA 発現を抑制し（150 nM で約 46% の阻害）、293T 細胞における TNF-α 刺激 NF-κB レポーター活性阻害に関して、Resveratrol よりも約 130 倍強力であることが示されています（IC_{50}=150 nM）。						
NF-κB Activation Inhibitor VI, BOT-64	113760-29-5	273.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）or Ethanol（10 mg/ml）	481414-5MG	35,000
6,6-Dimethyl-2-(phenylimino)-6,7-dihydro-5H-benzo[1,3]oxathiol-4-one	細胞透過性のベンゾキサチオール化合物。LPS 誘導性の NF-κB 活性化を阻害し、NF-κB 制御遺伝子転写およびその DNA 結合能を抑制します。LPS 誘導 RAW 264.7 細胞において IKKβ 媒介 IkBα リン酸化（IC_{50} < 3 µM）および複数の炎症メディエーターの産生を阻害します。また、LPS ショックマウスの生存率を向上させます（3 ～ 30 mg/kg, i.p.）。						
NF-κB SN50, Cell-Permeable Inhibitor Peptide		2781.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O（5 mg/ml）	481480-500UG	30,000
(AAVALLPAVLLALLAPVQRKRQKLMP)	転写因子 NF-κB p50 の核移行配列（NLS）に Kaposi 繊維芽細胞成長因子（K-FGF）のシグナルペプチド疎水性領域（h 領域）を連結したもの。N 末端の K-FGF h 領域は細胞透過性を付与し、NLS（360-369）は NF-κB 活性複合体の細胞核への移行を阻害します。LPS で誘導したマウス内皮 LE-II 細胞において、NF-κB の核移行を 18 µM で最大限に阻害します。						
NF-κB SN50M, Cell-Permeable Inactive Control Peptide		2668.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	H_2O（5 mg/ml）	481486-500UG	42,000
[(AAVALLPAVLLALLAPVQRNGQKLMP)]	SN50 ペプチド（製品番号 481480）の不活性対照。SN50 ペプチド配列の NLS 領域にある Lys^{363} を Asn に、Arg^{364} を Gly に置換したものです。本ペプチド（18 µM）は LPS で誘導したマウス内皮 LE-II 細胞における NF-κB の移行に対しての影響は認められません。						
Oridonin, *R. rubescens*	28957-04-2	364.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）. Use only fresh DMSO for reconstitution.	496915-5MG	23,000
	細胞透過性のジテルペノイド化合物。抗 NF-κB 活性を有し、増殖抑制作用 [ED_{50} 約 2.7 µg/ml（悪性リンパ腫細胞）] および血管新生抑制作用（2.5 µg/ml で HMEC-1 細胞のネットワーク形成を著しく阻害）を示します。DNA 合成に影響を及ぼし、アポトーシスを誘導し、細胞周期停止を引き起こすことが報告されています。Jurkat 細胞および RAW264.7 マウスマクロファージにおいて、TNF-α および LPS で誘導した NF-κB 活性を強力に阻害することが明らかになっています。また、NF-κB の DNA 結合活性を抑制することによって、核移行を妨げずに NF-κB 転写活性を阻害します（MT-1 細胞において IC_{50}= 約 5 µg/ml）。						
(5Z)-Zeaenol, *Curvularia sp.*	66018-41-5	364.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	499609-1MG	23,900
TAK1 Inhibitor, Inactive Control	レソルシン酸ラクトン化合物。細胞透過性。TAK1（TGF-β 活性化キナーゼ 1）阻害試験のネガティブコントロールとして最適です（IC_{50} = 0.69 µM）。						
(5Z)-7-Oxozeaenol, *Curvularia sp.*	66018-38-0	362.4	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（10 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）	499610-1MG	23,900
	天然物由来の真菌レソルシン酸ラクトン。細胞透過性。ATP 競合的かつ可逆的に MAPKKK TAK1 活性を選択的に阻害します（IC_{50} = 8 nM）。MEK1（IC_{50} =411 nM）および他の 3 種の MAPKKK については、はるかに高い濃度でしか阻害しません（MEKK1、ASK1 および MEKK4 に対して IC_{50} ≥ 268 nM）。IL-1 誘導 /TAK1- 媒介 JNK および p38 は阻害しますが、H_2O_2 誘導 /TAK1- 非依存性の JNK および p38 は阻害しないことが示されています。						
Parthenolide, *Tanacetum parthenium*	20554-84-1	248.3	≥ 97% by TLC	-20℃	DMSO（100 mg/ml）or ethanol（20 mg/ml）	512732-50MG	15,900
	抗炎症、抗分泌性および鎮痙性を有するセスキテルペン・ラクトン。LPS で刺激されたマクロファージにおいて、COX-2 および炎症誘発性サイトカイン（TNF-α、IL-1）の発現を阻害します。また、NF-κB および MAP キナーゼの活性化を阻害します。						
TIRAP Inhibitor Peptide, Cell-Permeable		3596.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	613570-1MG	55,900
[(RQIKIWFNRRMKWKKLQLRDAAPGGAIVS); Ant-Tirap$_{138-151}$; Mal Peptide; MyD88-Adapter-Like Peptide; TIRAP Peptide; Toll-interleukin 1 Receptor (TIR) domain-containing Adapter Protein Peptide]	マウス $TIRAP_{138-151}$ を含み、*Drosophila* のアンテナペディア配列と融合した細胞浸透性合成ペプチドです。RAW.κB 細胞において、約 40 µM で LPS 誘導性 NF-κB 活性化を特異的に阻害しますが、CpG 誘導性 NF-κB 活性化、PKR リン酸化および JNK リン酸化は阻害しません。IκBα の分解を阻害します。 H-Arg-Gln-Ile-Lys-Ile-Trp-Phe-Gln-Asn-Arg-Arg-Met-Lys-Trp-Lys-Lys-Leu-Gln-Leu-Arg-Asp-Ala-Ala-Pro-Gly-Gly-Ala-Ile-Val-Ser-OH						
TIRAP Inhibitor Peptide, Control, Cell-Permeable		3596.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	613571-1MG	55,000
[(RQIKIWFQNRRMKWKKSVIAGGPAADRLQL); Ant-Tirap$_{151-138}$; Mal Peptide; MyD88-Adapter Like Peptide; TIRAP Peptide, Control; Toll-interleukin 1 Receptor (TIR) domain-containing Adapter Protein Peptide]	TIRAP 阻害ペプチド（製品番号 613570）のネガティブコントロール。細胞浸透性合成ペプチド。マウス $TIRAP_{151-138}$ を含んだ逆転配列であり、*Drosophila* アンテナペディア配列と融合しています。						

NF-κB Signaling Cascade



一酸化窒素・酸化ストレス

Arginase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
BEC, Hydrochloride		229.5	≥ 97% by NMR	-20℃	H_2O (10 mg/ml)	197900-5MG	40,900
[(S)-(2-Boronoethyl)-L-cysteine, HCl)]	ホウ酸型アルギニンアナログでアルギナーゼ I と II の結合速度の遅い競合的遷移状態阻害剤 (K_i = 310 nM for human recombinant type II arginase, pH 7.5)。nitric oxide synthase (NOS) を阻害しません。 human penile corpus cavernosum tissue において NO 依存性の平滑筋弛緩を強力に促進します。						
DL-α-Difluoromethylornithine, Hydrochloride	96020-91-6	236.7	≥ 99% by TLC	room temp.	H_2O (1 mg/ml) or Methanol (25 mg/ml)	288500-25MG	19,000
	ポリアミン生合成の律速酵素であるオルニチンデカルボキシラーゼ (ODC) の特異的阻害剤や不可逆阻害剤として働く細胞透過性の抗癌剤。B16 メラノーマ誘発性の血管形成 *in vivo* と血管内皮細胞 *in vitro* の増殖を阻害します。						
NG-Hydroxy-L-arginine, Monoacetate Salt	53598-01-9	250.3	≥98% by elemental analysis	-20℃	H_2O (1 mg/ml)	399250-5MG	25,000
(NOHA, AcOH)	恒成的一酸化窒素シンセターゼ (cNOS) による一酸化窒素生合成の重要な中間生成物。NOHA はチトクローム P450 系により効率的に酸化されて一酸化窒素およびシトルリンを生成します。肝臓およびマクロファージアルギナーゼの強力な阻害剤です (K_i = 150 μM)。						
Nω-Hydroxy-nor-L-arginine, Diacetate Salt	189302-40-7	296.3	≥ 97% by TLC	-20℃	H_2O (50 mg/ml)	399275-1MG 399275-5MG	10,000 20,000
[L-2-Amino-(4-(2'-hydroxyguanidino)butyric Acid, $2CH_3CO_2H$; nor-NOHA, $2CH_3CO_2H$]	アルギナーゼの選択的、可逆的、競合的、かつ抗親和性である強力な阻害剤。ラット肝臓 (IC_{50} = 2 μM) およびマウスマクロファージ (IC_{50} = 50 μM) のアルギナーゼを阻害します。酵素活性部位のマンガナーゼクラスターと特異的に相互作用することが示されています。NOS の基質あるいは阻害剤としては作用しません。このため、アルギナーゼと NOS との相互作用の研究に有用な試薬となります。						
Ornithine Decarboxylase Inhibitor, POB		397.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O (1 mg/ml)	497985-10MG	21,000
N-(4'-Pyridoxyl)-Ornithine(BOC)-Ome	細胞透過性のピリドキシル - オルニチン化合物。オルニチン脱炭酸酵素 (ODC) の活性部位に結合し、ODC 細胞活性の遷移状態アナログ阻害剤として作用します。腫瘍細胞成長の停止において DFMO (製品番号 288500) より強力 (約 5 ～ 10 倍) で ODC 発現レベルにはほとんど影響を与えないことが示されています。						

Guanylate Cyclase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
LY 83583	91300-60-6	250.2	≥ 98% by TLC and HPLC	+4℃	Acetone or Ethanol (3 mg/ml)	440205-5MG 440205-25MG	19,900 68,900
(6-Anilino-5,8-quinolinequinone)	可溶性グアニル酸シクラーゼの競合的阻害剤 (IC_{50} = 2 μM)。細胞内 Ca^{2+} の放出を遮断することにより、多様な組織の cGMP 産生レベルを低下させます。このとき cAMP レベルにはほとんど影響しません。一酸化窒素の誘導による平滑筋の弛緩を阻害します。培養ラット大動脈平滑筋細胞において、インターロイキン 1 の誘導による cGMP の蓄積を阻害することが示されています。また NO 供与体の誘導による好中球の化学走性も阻害します。						
Methylene Blue	61-73-4	319.8		room temp.	H_2O (40 mg/ml)	457250-1GM	8,000
[3,7-*bis*(Dimethylamino)phenothiazin-5-ium Chloride]	可溶性グアニル酸シクラーゼの阻害剤。溶液中で、酸素フリーラジカルと安定した付加生成物を形成する有機スピントラップ試薬です。生物学的染色試薬です。色素含有量は 87%以上です。						
NS 2028	204326-43-2	269	≥ 98% by NMR	+4℃	DMSO (5 mg/ml), Ethanol (5 mg/ml), or $CHCl_3$ (1 mg/ml)	492030-5MG	40,000
[4H-8-Bromo-1,2,4-oxadiazolo(3,4-d)benz(b)(1,4)oxazin-1-one]	可溶性グアニリルシクラーゼの強力、特異的かつ非可逆的なインヒビター (基底状態では IC_{50} = 30 nM、NO 刺激酵素活性では 200 nM、マウス小脳ホモジェネートにおいて S- ニトロソグルタチオンで強化した可溶性グアニリルシクラーゼ活性については IC_{50} = 17 nM)。						
ODQ	41443-28-1	187.2	≥ 98% by TLC and HPLC	-20℃	DMSO (25 mg/ml)	495320-10MG	35,900
(1H-[1,2,4]Oxadiazolo[4,3-a]quinoxalin-1-one)	酸化窒素 (NO) 感受性グアニリルシクラーゼの強力かつ選択的な阻害剤 (IC_{50} = 20 nM)。インキュベートした小脳切片において、ODQ は NOS 活性に影響を及ぼすことなく、グルタミン酸受容体アゴニストに対する NO 依存性 cGMP 反応を可逆的に阻害します。NO を化学的に不活化するものではなく、NO ドナーに反応した cGMP 生成を阻害します。ODQ は cGMP に無関係な現象である NO 媒介マクロファージ毒性を阻害したり、粒子性グアニリルシクラーゼやアデニリルシクラーゼの活性には影響しません。						

Nitric Oxide Synthase (NOS) 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
1400W		250.2	≥ 95% by HPLC	-20℃	Methanol (5 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	100050-5MG	27,900
[N-(3-Aminomethyl)benzylacetamidine, 2HCl]	誘導型一酸化窒素合成酵素 (iNOS) の選択的、細胞透過性、不可逆的、遅効性、強結合阻害剤 (K_d= 7 nM)。*in vitro*、*in vivo* のどちらの系における使用にも適しています。虚血病変の容積を減少させることによって脳虚血に対する保護作用を示します。ヒトの iNOS に対しては eNOS および nNOS と比較してそれぞれ 5,000 倍および 200 倍以上の活性を示し、ラットの iNOS に対しては eNOS と比較して 1,000 倍以上の活性を示します。						
Caveolin-1 Scaffolding Domain Peptide, Cell-permeable		4746.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (2 mg/ml)	219482-1MG	64,000
(AP-Cav; Cavtratin; Pen-C1-SD; RQIKIWFQNRRMKWKK-DGIWKASFTTFTVTKYWFYR)	カベオリン 1 スキャフォールドドメインペプチド (C1-SD82-101)。N 末端に細胞透過性のアンテナペディア内部移行配列 (43 - 58) を融合。このペプチドは *in vitro* で eNOS 活性および細胞の NO 放出を妨げ、*in vivo* で炎症および腫瘍形成を抑えることが報告されています。カベオリン 1 は C1-SD82 101 配列を介して EGFR や eNOS、G タンパク質 α サブユニット、PKCα、H-Ras および Src など、いくつかの脂質修飾シグナル伝達リガンドと相互作用します。						
Caveolin-1 Scaffolding Domain Peptide, Cell-permeable, Negative Control		4746.6	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (2 mg/ml)	219483-1MG	59,000
(AP-Cav-X; Pen-C1-SD-X; RQIKIWFQNRRMKWKK-WGIDKASFTTFTVTKYWFRY)	配列をスクランブルしたカベオリン 1 スキャフォールドドメインペプチド (C1-SD82-101)。N 末端に細胞透過性のアンテナペディア内部移行配列 (43 - 58) を融合。Caveolin-1 Scaffolding Domain Peptide、Cell-permeable (製品番号 219482) を用いた試験のネガティブコントロールとして有用です。						
Dexamethasone	50-02-2	392.5	≥ 99% by TLC	+4℃	DMSO (25 mg/ml), chloroform or Ethanol	265005-100MG	7,900
(9α-Fluoro-16α-methylprednisolone)	活性が高く、極めて安定なグルココルチコイド。サイクリン A および Cdk2 の活性の低下、および骨芽細胞における G_1/S 期移行の阻害を誘発します。網膜芽細胞腫 (Rb) タンパク質のリン酸化を阻害します。血管内皮細胞において、誘導型一酸化窒素合成酵素の発現を阻害します (IC_{50} = 5 nM) が、構成型一酸化窒素合成酵素の発現は阻害しません。Na^+ - K^+ ポンプを活性化することによって、大動脈平滑筋細胞におけるカチオンの能動輸送を促進します。ヒト胸腺細胞においてアポトーシスを誘導します。						

一酸化窒素・酸化ストレス

Nitric Oxide Synthase（NOS）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Diphenyleneiodonium Chloride （DPI）	4673-26-1	314.6	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）. Slight warming is required for complete solubility.	300260-10MG	18,900
内皮型一酸化窒素合成酵素（eNOS）の不可逆的阻害剤。前狭窄ラット胸部大動脈輪のアセチルコリン誘発弛緩を阻害することが示されています（IC_{50} = 180 nM）。また、マクロファージの iNOS に対しても阻害作用を示します（IC_{50} = 50 nM）。大動脈平滑筋細胞において、K^+ 電流および Ca^{2+} 電流を遮断します。ミトコンドリアの NADPH- ユビキノンオキシドリダクターゼの阻害剤です。							
NG,NG-Dimethyl-L-arginine, Dihydrochloride （ADMA, 2HCl）	65005-57-4	275.2	≥ 98% by TLC	-20℃	H_2O（50 mg/ml）	311203-25MG	28,900
in vitro（IC_{50} = 2-3 μM）および *in vivo* における一酸化窒素合成酵素の可逆的阻害剤。用量依存的な血管収縮作用および徐脈作用を誘発します。							
N(G),N(G)'-Dimethyl-L-arginine, DiHCl （SDMA, 2HCl）		275.2	≥ 98% by TLC	room temp.	H_2O（50 mg/ml）	311204-25MG	17,900
in vitro および *in vivo* における一酸化窒素合成の内因性阻害剤。NOS 活性に対しては顕著な阻害作用を示しません。							
Glucocorticoid Receptor Modulator, CpdA [2-((4-Acetoxyphenyl)-2-chloro-N-methyl) ethylammonium chloride]		264.2	≥ 97% by HPLC	-70℃	Ethanol（anhydrous, 5 mg/ml）, DMSO（10 mg/ml）, or H_2O（1 mg/ml）	346110-25MG	36,000
細胞透過性のアジリジン前駆体。非ステロイド系 Glucocorticoid（GC）Receptor（GR）のリガンドとして作用し、Dexamethasone（DEX、製品番号 265005）より 4 倍高い結合親和性を示します。GR の核移行を誘導し、NF-κB 依存性の炎症促進性サイトカイン産生の GR を介した transrepression を選択的に活性化します。DEX とは異なり、CpdA は GRE（GC 応答因子）による遺伝子発現に対する作用を示しません。*in vivo* マウスにおける急性炎症の抑制効果は DEX と同程度ですが、DEX で一般的に見られる高血糖の副作用を示しません。							
L-N5-（1-Iminoethyl）ornithine, Dihydrochloride （L-NIO, 2HCl）		246.1	≥ 98% by TLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	400600-20MG	23,900
内皮一酸化窒素合成酵素（eNOS）阻害剤（IC_{50} = 500 nM）。L-NAME（製品番号 483125）および L-NMMA（製品番号 475886）などの他のアルギニンよりも強力です。アセチルコリン誘導によるラット大動脈環の弛緩を阻害します（IC_{50} = 2 μM）。またラットの平均動脈血圧を用量依存的に増加させます（EC_{50} = 19.5 mg/kg）。							
Melatonin （N-Acetyl-5-methoxytryptamine; 5-Methoxy-N-acetyltryptamine）	73-31-4	232.3	≥ 98% by HPLC	+4℃	Ethanol（5 mg/ml）	444300-1GM	13,900
光周性哺乳類の、光誘導性抗ゴナドトロピン活性メディエータ。骨髄細胞において、エトポシドによるアポトーシス活性を抑制します。G タンパク質と共役します。ラット小脳一酸化窒素シンセターゼ（NOS）を阻害します。過酸化窒素スカベンジャーとしても作用します。							
S-Methylisothiourea, Sulfate （2-Methyl-2-thiopseudourea, Sulfate; SMT）	867-44-7	278.4	≥99% by elemental analysis	room temp.	H_2O	466220-100MG	11,000
誘導性一酸化窒素合成酵素（iNOS）の高選択性阻害剤。免疫刺激培養マクロファージ（EC_{50} = 6 μM）および血管平滑筋（EC_{50} = 2 μM）に対し、L-NMMA（製品番号 475886）の 10-30 倍の iNOS 阻害効力を示すと報告されています。							
S-Methyl-L-thiocitrulline, Dihydrochloride [N^{ω}-(S-Methyl)isothioureido-L-ornithine]		278.2	≥ 90% by TLC	+4℃	H_2O	472804-10MG	30,000
ラット神経一酸化窒素合成酵素（IC_{50} = 300 nM）に対して、内皮性酵素（IC_{50} = 5.4 μM）の約 17 倍の選択性を示す、一酸化窒素合成酵素の阻害剤です。							
NG-Monomethyl-L-arginine, Monoacetate Salt （N^{ω}-Me-L-Arg; N^{G}-Me-L-Arg, AcOH; L-NMMA）	53308-83-1	248.3	≥ 99% by TLC; ≥ 99% by HPLC	room temp.	H_2O（50 mg/ml）or Methanol	475886-25MG 475886-50MG 475886-100MG	11,900 19,000 34,000
一酸化窒素合成酵素の 3 つのアイソフォームすべての競合阻害剤として働く L- アルギニン類似体（eNOS に対して IC_{50} = 700 nM、iNOS に対して IC_{50} = 3.9 μM、nNOS に対して IC_{50} = 650 nM）。ノルエピネフリンで収縮させた無損傷のモルモット肺動脈に対して、ヒスタミンおよびアセチルコリンが弛緩を誘導するのを阻害します（IC_{50} = 9.5 μM）。							
L-NIL, Dihydrochloride [L-N^6-(1-Iminoethyl)lysine, DiHCl]		260.6	≥ 98% by TLC	-20℃	H_2O（100 mg/ml）	482100-10MG	32,900
一酸化窒素合成酵素の選択的かつ強力な阻害剤。ラット脳の構成型酵素（IC_{50} = 92 μM）に比べ、誘導性の一酸化窒素合成酵素に対し約 28 倍高い選択性を示します（IC_{50} = 3.3 μM）。また、γ- インターフェロン誘導 NO_2^- 生産の阻害において、N^G- モノメチル -L- アルギニン（L-NMMA; 製品番号 475886）よりも、約 10 倍高い阻害能力を示します（IC_{50} = 460 nM）。							
NG-Nitro-L-arginine Methyl Ester, Hydrochloride （L-NAME, HCl; N^{ω}-NO_2-L-Arg-OMe; N^{G}-NO_2-L-Arg-OMe）	51298-62-5	269.7	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O（50 mg/ml）	483125-100MG	4,900
アルギニンよりも可溶な類似体であり、ゆっくりと可逆性を示す競合的 eNOS インヒビター（IC_{50} = 500 nM）。ラット大動脈リングのアセチルコリン誘導性弛緩を持続的に阻害します（IC_{50} = 400 nM）。							
7-Nitroindazole （7-Ni）	2942-42-9	163.1	≥ 97% by TLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）or Methanol（5 mg/ml）	483400-100MG	24,900
一酸化窒素合成酵素（NOS）の可逆的かつ競争的な阻害剤。iNOS（IC_{50} = 20 μM）に比べ、脳酵素に対して高い選択性を示します（IC_{50} = 710 nM）。また、ウシ内皮の一酸化窒素合成酵素も阻害します（IC_{50} = 800 nM）。NOS のヘム基に結合。							
***p*-Nitroblue Tetrazolium Chloride** （NBT; Nitro BT）	298-83-9	817.6	≥ 98% by TLC	+4℃	MeOH or H_2O	484235-250MG 484235-1GM	11,000 35,000
一酸化窒素合成酵素を競合的に阻害する NADPH- ジアホラーゼ基質（IC_{50} = 3 - 4 μM）。スーパーオキシドアニオンのスカベンジャーとして知られています。アルカリフォスファターゼの基質として有用であり、しばしば BCIP（製品番号 203788）と併せて用いられます。							
nNOS Inhibitor I [(4S)-N-(4-Amino-5[aminoethyl]aminopentyl)-N'-nitroguanidine, TFA]	357965-99-2	625.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O（1 mg/ml）	490070-5MG	56,900
神経細胞酸化窒素シンターゼ（nNOS）の強力かつ非常に選択的な阻害剤（K_i=120 nM）。eNOS および iNOS に比べ、それぞれ 2500 倍以上と 320 倍の選択性を示します。							

一酸化窒素・酸化ストレス

Nitric Oxide Synthase（NOS）阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
1-Pyrrolidinecarbodithioic Acid, Ammonium Salt	5108-96-3	164.3	> 98% by titration	+4℃	H_2O（1 mg/ml）	548000-100MG	10,000
（Ammonium Pyrrolidinedithiocarbamate; APDC; PDTC, NH_4）	ラット肺胞マクロファージの NO シンセターゼ活性の誘導を阻害します。ヒト HL-60 細胞および胸腺細胞のアポトーシスは阻害しますが、ヒトおよびラット平滑筋細胞のアポトーシスは誘導します。リンパ球の NF-κB の活性化および HIV 複製を阻害します。						
SKF-525A, Hydrochloride	62-68-0	390	≥ 98% by TLC	-20℃	H_2O（20 mg/ml）	567300-1GM	61,000
（Proadifen）	グリベンクラミド感受性 K^+ チャネルをブロックします。神経細胞一酸化窒素合成酵素を阻害（IC_{50} = 90 μM）。また、チトクローム P450 系を阻害することにより、肝臓の薬物代謝を阻害します。内皮細胞のプロスタサイクリン生産を刺激する一方、血小板のトロンボキサン合成を阻害します。*in vivo* で多くの薬剤の作用を強化します。						
Spermidine, Trihydrochloride	334-50-9	254.6	≥ 98% by TLC	room temp.	Ethanol or H_2O	56766-5GM	31,000
	細胞の増殖および分化の調節に重要な役割を果たすポリアミン。神経細胞一酸化窒素合成酵素を阻害します。						
Zinc（II）Protoporphyrin IX	15442-64-5	626	≥ 95% by TLC	-20℃	DMF or Pyridine	691550-25MG	15,900
（ZnPP-9）	一酸化炭素（CO）とビリベルジンを生成する酵素である、ヘムオキシゲナーゼの強力かつ選択的な阻害剤。可溶性グアニリルシクラーゼを阻害し、一酸化窒素合成酵素の 3 つすべてのアイソフォームを時間と濃度に依存的に不活化します（nNOS、iNOS および eNOS について、それぞれ IC_{50} = 800 nM、4.0 μM および 5.0 μM）。単離したラット大動脈において、アセチルコリン、ANP および VIP によって誘導される弛緩を阻害します。インターロイキン 1 をブロックし、長期増強の誘導を妨げます。また、鉄欠乏性赤血球産生の指標としても有用です。血液脳関門を通過しません。						

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
C5a Receptor Antagonist, W-54011	405098-33-1	493.1	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）or Methanol（50 mg/ml）	234415-1MG 234415-5MG	25,900 74,900
[N-((4-Dimethylaminophenyl)methyl)-N-(4-isopropylphenyl)-7-methoxy-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-carboxamide, HCl]	テトラヒドロナフタレニル - カルボキサミド化合物。強力かつ特異的な経口活性 C5a 受容体アンタゴニストとして作用します。125I-rhC5a のヒト好中球への結合を阻害し（K_i=2.2 nM）、C5a による細胞内 Ca^{2+} 動員（IC_{50}=3.1 nM）、走化性（IC_{50}=2.7 nM）および活性酸素種（ROS）生成（IC_{50}=1.6 nM）を抑制することが明らかになっています。濃度 10 μM までアゴニスト作用を示しません。また、アレチネズミにおいて C5a 誘導性好中球減少を抑制します（3-30 mg/kg 経口投与）。						
Deoxyhypusine Synthase Inhibitor, GC7	150333-69-0	270.35	> 95% by NMR	-20℃	H_2O	259545-10MG	23,900
β-Glucuronidase Inhibitor		425.5	≥ 99% by HPLC	-20℃	DMSO	347423-10MG	38,900
IRE1 Inhibitor I, STF-083010		317.4	≥ 98% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	412510-10MG	18,900
ICMT Inhibitor		376.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	420350-10MG	44,900
Luteolin	491-70-3	286.2	≥ 90% by HPLC	+4℃	Aqueous alkaline solutions（1.4 mg/ml），DMSO（7 mg/ml），or Ethanol	440025-5MG	16,000
（3′,4′,5,7-Tetrahydroxyflavone）	フリーラジカルスカベンジャーである抗酸化性フラボノイド。ラット肝細胞質のグルタチオン S- トランスフェラーゼ活性を阻害します。また Raji リンパ腫細胞に対して細胞毒性作用を示します。非腫瘍細胞株 C3H10T1/2CL8 をルテオリンと共にインキュベーションすると、p53 の蓄積とアポトーシスが誘発されます。アポトーシスは細胞周期の G_2/M 期で起こります。						
NOX Inhibitor III, VAS2870	722456-31-7	360.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	492000-10MG	25,900
NOX1 Inhibitor, ML171	6631-94-3	241.31	≥ 95% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	492002-10MG	18,900
PAD Inhibitor, Cl-amidine		424.8	> 95% by HPLC	-20℃	DMSO	506282-10MG	54,900
ROS Inhibitor, YCG 063	330997-95-0	419.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO or EtOH	557354-5MG	29,900
SOD1 Inhibitor, LCS-1	41931-13-9	255.1	≥ 99% by HPLC	-20℃	DMSO	567417-10MG	18,900

PARP、PARG 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
ADP-HPD, Dihydrate, Ammonium Salt		595.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (5 mg/ml)	118415-60UG	40,900
						118415-1SET	122,900
[Adenosine 5′-diphosphate (Hydroxymethyl) pyrrolidinediol, NH_4]	ADP- リボースのアミノアナログ。ポリ（ADP- リボース）糖加水分解酵素（PARG）に対する極めて強力かつ非競合的な特異的阻害剤として作用します（IC_{50} = 120 nM）。ポリ（ADP- リボース）ポリメラーゼ（PARP）および NAD: アルギニンモノ（ADP- リボシル）- トランスフェラーゼの活性に対しては、1 mM の濃度においても影響を及ぼしません。また、*Bungarus fasciatus* 毒由来の NAD 糖加水分解酵素の阻害剤としても作用します（IC_{50} = 260 µM）。						
3-Aminobenzamide	3544-24-9	136.2	≥ 97% by TLC	room temp.	DMSO（5 mg/ml）, Ethanol（1 mg/ml）, or H_2O（1 mg/ml）	165350-100MG	10,900
(3-Aminobenzamide)	ポリ（ADP- リボース）ポリメラーゼ（PARP）の阻害剤として作用する増殖抑制剤。細菌毒素による ADP リボシル化に対する作用は微弱です。本品は、UV 誘導性アポトーシスの阻害剤です。また、ヒトエフェクターナチュラルキラー細胞による K562 標的細胞死も強力に阻害します。						
DPQ	129075-73-6	302.4	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO（5 mg/ml）	300270-1MG	22,900
{3,4-Dihydro-5[4-（1-piperindinyl）butoxy]-1（2H）-isoquinoline}	ポリ（ADP- リボース）ポリメラーゼ（PARP）に対する強力かつ選択的な阻害剤です（IC_{50} = 40 nM）。						
PARP Inhibitor IX, EB-47		646.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	H_2O (50 mg/ml)	324473-1MG	20,000
	PARP-1 の強力な阻害剤として働く、細胞透過性のアデノシン置換イソインドリノン化合物（IC_{50} = 45 nM）。細胞中ならびに再灌流損傷および炎症の *in vivo* モデルにおける酸化的損傷に対して、細胞保護効果をもたらすことが示されています。						
1,5-Isoquinolinediol	1188540	161.2	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO（30 mg/ml）, 100 mM NaOH（5 mg/ml）, or Methanol（8 mg/ml）	419800-5MG	18,000
[1,5-Dihydroxyisoquinoline; 5-Hydroxy-1（2H）-isoquinoline; 1,5-Isoquinolinediol]	ポリ（ADP- リボース）シンセターゼ（PARS）の強力な阻害剤（IC_{50} = 390 nM）。						
NU1025	90417-38-2	176.2	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO（25 mg/ml）. This solution can be further diluted 1:100 in tissue culture medium before use.	493800-5MG	35,000
(8-Hydroxy-2-methylquinazoline-4-one)	強力なポリ（ADP- リボース）ポリメラーゼ（PARP）阻害剤（IC_{50} = 0.40 µM）。マウス L210 白血病細において、DNA メチル化剤の MTIC [5-（3-N-methyltriazen-1-yl）-imidazole-4-carboxamide] および電離照射による細胞毒性を高めることが示されています。						
PJ34	344458-15-7	331.8	≥ 98% by HPLC	-20℃	H_2O (5 mg/ml)	528150-1MG	15,900
						528150-5MG	48,900
	ポリ（ADP- リボース）ポリメラーゼ（PARP）の強力な阻害物質として作用する水溶性フェナン - トリジノン誘導体（EC_{50} = 20 nM）。プロトタイプ PARP 阻害物質である 3- アミノベンズアミド（製品番号 165350）より 10,000 倍強力であることが示されています（EC_{50} = 200 µM）。高濃度（1 µM ～ 10 mM）で用いた場合でも抗酸化作用を示します。卒中時に神経保護作用を示します。						
PARP Inhibitor XI, DR2313	284028-90-6	182.2	≥ 98% by HPLC	+4℃	H_2O (30 mg/ml)	528819-5MG	32,900
(2-Methyl-3,5,7,8-tetrahydrothiopyrano[4,3-d] pyrimidine-4-one)	脳透過性の水溶性ピリミジノン化合物。 PARP の強力な NAD+ 競合阻害剤（rhPARP1, rmPARP2 に対してそれぞれ IC_{50} = 200 nM、240 nM）。 GAPDH, ADH, LDH のデヒドロゲナーゼ活性にはほとんど活性を示しません。また、細菌性ジフテリア毒素の ADP リボシル化活性は 10 µM でも阻害しません。*in vitro* でラット大脳皮質初代培養における H_2O_2 誘導性 PAJR 形成と神経細胞死を阻害し（EC_{50} = 270 nM）、*in vivo* でラットの持続性・一過性の局所的虚血モデルにおいて神経保護作用を示します。						
PARP Inhibitor XII		283.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	528822-5MG	46,000
[3-（4-Chlorophenyl）quinoxaline-5-carboxamide]	脳に浸透するキノキサリン化合物。強力かつ選択的な PARP 阻害剤として作用します（PARP-1 および PARP-2 に対する IC_{50} = 33 nM および 7 nM）。						
PARP Inhibitor XIV	1104546-89-5	252.3	≥ 97% by HPLC (sum of two isomers)	+4℃	DMSO（10 mg/ml）	528824-10MG	23,000
4-（1-Methyl-1H-pyrrol-2-ylmethylene）-4H-isoquinoline-1,3-dione	100 倍低い有効性で PPAR-2 活性に影響を及ぼす一方、NAD^+ 競合的、可逆的に PARP-1 活性（pIC_{50} = 7.35; IC_{50} = 45 nM）を有効に阻害する細胞透過性イソキノリンジオン化合物。PARP-1 介在細胞 PAR 配列を選択的に阻害し、*parp-1* $^{(-/-)}$ マウス由来の fibroblasts における PAR 配列に対してほとんど影響を及ぼしません。その *in vivo* 応用は不十分な水溶解度（～ 9 µM）により限定されています。						
SecinH3	853625-60-2	460.5	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO（50 mg/ml）	565725-5MG	48,900
[N-（4-（5-（1,3-Benzodioxol-5-yl）-3-methoxy-1H-1,2,4-triazol-1-yl）phenyl）-2-（phenylthio）acetamide; Cytohesins Inhibitor SecinH3]	細胞透過性のトリアゾロ化合物。Sec7 特異的 GEF（グアニンヌクレオチド交換因子）活性およびショウジョウバエの Step（Steppke）タンパク質の阻害剤として作用し、インシュリンシグナル経路をブロックします。ARNO/ サイトヘシン -Sec7 ドメインに高い親和性で優先的に結合し（K_d= 約 200 ～ 250 nM）、ＡＤＰリボシル化因子（ARF）の GDP/GTP 交換活性を抑制します（IC_{50}= 約 2.4 ～ 5.6 µM）。IR によって pIRS-1 を選択的に阻害することが示されており、マウスモデルにおいてインシュリン耐性を示します。						

Phosphodiesterase 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Chlorpromazine, Hydrochloride	**69-09-0**	**355.3**	**≥ 99% by titration**	**room temp.**	**H_2O (50 mg/ml) or Methanol (10 mg/ml)**	**215921-500MG**	**16,900**
{2-Chloro-10-[3′-(dimethylamino)propyl] phenothiazine, HCl}	環状ヌクレオチドフォスフォジエステラーゼのカルモジュリン依存性活性化を阻害します（IC_{50} = 17 μM）。末梢血管拡張剤として作用します。リソソームスフィンゴミエリナーゼおよび TNF-α 産生に対する阻害作用を示します。マウス脳において一酸化窒素合成酵素（NOS）を阻害し、マウス肺においてリポ多糖による NOS 誘導を抑制します。また、強力な PLA_2 阻害剤としても作用します。						
Cilostamide	**68550-75-4**	**342.4**	**≥ 98% by TLC**	**+4℃**	**DMSO (5 mg/ml)**	**231085-10MG**	**41,000**
[N-Cyclohexyl-N-methyl-4-(1,2-dihydro-2-oxo-6-quinolyloxy)butyramide; OPC 3689]	cGMP 阻害性フォスフォジエステラーゼ（PDE III）の選択的阻害剤（IC_{50} = 70 nM）。						
Denbufylline	**57076-71-8**	**320.4**	**≥ 97% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO (10 mg/ml) or Methanol (100 mg/ml)**	**253500-5MG**	**33,000**
[1,3-Di-*n*-butyl-7-(2′-oxopropyl)xanthine]	キサンチン誘導体。フォスフォジエステラーゼ IV（PDE IV）の選択的阻害剤として作用します（K_i 約 1 μM）。気管支拡張作用を有します。モルモット心室乳頭筋において、カルシウムチャネルのベラパミル感受性部位に作用することによって陰性変力作用を示します。これは、本品の PDE 阻害活性には関連しない作用です。						
EHNA, Hydrochloride	**51350-19-7**	**313.8**	**≥ 97% by TLC**	**+4℃**	**H_2O (25 mg/ml)**	**324630-10MG**	**15,900**
[*erythro*-9-(2-Hydroxy-3-nonyl)adenine, HCl]	フォスフォジエステラーゼ II（PDE II）の強力な阻害剤（IC_{50} = 800 nM）。他の PDE アイソザイムに対しては阻害作用を示しません（IC_{50} >100 μM）。また、アデノシンデアミナーゼを阻害します（K_i = 4 nM）。						
Trequinsin, Hydrochloride	**78416-81-6**	**442**	**≥ 98% by HPLC**	**room temp.**	**H_2O (500 μM)**	**382425-10MG**	**48,000**
[9,1-Dimethoxy-2-mesitylimino-3-methyl-2,3,6,7-tetrahydro-4H-pyrimido-(6,1-a)-isoquinolin-4-one, HCl; HL 725]	cGMP 阻害フォスフォジエステラーゼ（IC_{50} = 300 pM）および *in vitro* における血小板凝集を非常に強く阻害します。アデノシンの刺激による cAMP の蓄積を促進します。						
3-Isobutyl-1-methylxanthine	**28822-58-4**	**222.2**	**≥ 98% by TLC**	**-20℃**	**DMSO (100 mM), Ethanol (10 mg/ml), or Methanol (50 mg/ml). Heating may be required to achieve complete solubilization.**	**410957-250MG** **410957-1GM**	**8,900** **21,900**
(IBMX)	cAMP および cGMP フォスフォジエステラーゼの非特異的阻害剤（IC_{50} = 2-50 μM）。アデノシン受容体拮抗物質としても作用します。脂肪細胞前駆細胞における TNF-α の発現の阻害が報告されています。						
8-Methoxymethyl-3-isobutyl-1-methylxanthine	**78033-08-6**	**266.3**	**≥ 98% by TLC**	**room temp.**	**DMSO (5 mg/ml) or Ethanol (2 mg/ml)**	**454202-10MG**	**30,000**
(8-Methoxymethyl-IBMX)	Ca^{2+} カルモジュリン依存性フォスフォジエステラーゼ（PDE I）の選択的阻害剤（IC_{50} = 4 μM）。						
Milrinone	**78415-72-2**	**211.2**	**≥ 97% by TLC**	**-20℃**	**DMSO (20 mg/ml) or Ethanol (3 mg/ml)**	**475840-10MG**	**45,000**
[1,6-Dihydro-2-methyl-6-oxo-(3,4′-bipyridine)-5-carbonitrile]	cGMP 阻害性フォスフォジエステラーゼ（PDE III）の選択的阻害剤（IC_{50} = 300 nM）。 心臓に対して強力な変時性、変力性および血管拡張作用を示します。						
Nicotinamide Phosphoribosyltransferase Inhibitor, FK866	**658084-64-1**	**391.5**	**≥ 97% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO (100 mg/ml)**	**481908-2MG**	**14,000**
(*E*)-N-(4-(1-Benzoylpiperidin-4-yl)butyl)-3-(pyridin-3-yl)acrylamide	NPRT（ニコチン酸ホスホリボシルトランスフェラーゼ）活性（10 nM 時で NAPRT 活性を 82% 阻害、K-562 抽出物において 1 μM 時で NPRT 活性の阻害なし）に対して影響を及ぼさない一方、選択的でアロステリックな NAPRT/NAMPT（ニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼ）阻害剤（K_i = 0.4 nM m、酵素／基質複合体用；K_i' = 0.3 nM 、遊離型酵素用）として働く細胞透過性 pyridinylacrylamide 化合物。FK866 処理は、HepG2 ならびに NIH-3T3 培養（>95%、10 nM FK866 の処理 24 h 後）において NAD+（Cat. Nos. 481911 & 481915）を枯渇させることによって細胞死を誘発することが示されています。同じように、外因性 NAD+ の追加は FK866 誘発性 NAD+- 枯渇と細胞死から NIH-3T3 ならびに SH-SY5Y を救うことが明らかになっています。						
Rolipram	**61413-54-5**	**275.4**	**Single spot by TLC**	**+4℃**	**DMSO**	**557330-5MG**	**36,900**
{4-[3-(Cyclopentyloxy)-4-methoxyphenyl]-2-pyrrolidinone}	cAMP 特異的フォスフォジエステラーゼ（PDE IV）の選択的阻害剤（IC_{50} = 800 nM）。なお、ロリプラムに非感受性の PDE IV サブタイプも存在することが知られています。また、Jurkat 細胞と初代培養 T 細胞において、NF-κB および NFAT の活性化を阻害します。						
Ro-20-1724	**29925-17-5**	**278.4**	**≥ 98% by TLC**	**room temp.**	**DMSO (20%) or ethanol (4%)**	**557502-100MG**	**15,000**
[4-(3-Butoxy-4-methoxybenzyl)-2-imidazolidinone]	cAMP 特異的フォスフォジエステラーゼ（PDE IV）の選択的阻害剤（IC_{50}=2 μM）。スーパーオキサイドの生成およびアラキドン酸誘導性の血小板凝集を阻害します。また、fMLP が誘導する好中球の血管内皮細胞への接着も阻害します。						
Zaprinast	**37762-06-4**	**271.3**	**≥ 98% by TLC**	**room temp.**	**DMSO (25 mg/ml) or ethanol (5 mg/ml)**	**684500-25MG**	**13,000**
[1,4-Dihydro-5-(2-propoxyphenyl)-7H-1,2,3-triazolo[4,5-d]pyrimidine-7-one; M & B22948]	cGMP 特異的フォスフォジエステラーゼ（PDE V）の選択的な阻害剤（IC_{50} = 450 nM）。より高い濃度では PDE IX も阻害します（IC_{50} = 35 μM）。また、高血圧自然発生ラット（SHR）の血漿中の cGMP レベルを増やし、*in vitro* でニトログリセリン耐容性を反転させることが知られています。酸化窒素の血管拡張効果を増強します。						

タンパク質合成 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Luciferase Inhibitor I	352341-26-5	253.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	119113-5MG	19,900
Luciferase Inhibitor II	10205-56-8	254.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO or EtOH	119114-5MG	19,900
AKR1C1 Inhibitor, 5-PBSA	4906-68-7		≥ 94% by HPLC	+2℃～+8℃	DMSO	123850-25MG	38,900
Anisomycin, *Streptomyces griseolus*	22862-76-6	265.3	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or Methanol (50 mg/ml)	176880-10MG	13,000
[2-(*p*-Methoxybenzyl)-3,4-pyrrolidinediol-3-acetate]	哺乳類細胞において、ストレス活性化プロテインキナーゼ（JNK/SAPK）および p38 MAP キナーゼを強力に活性化します。強力なシグナル伝達促進因子として作用することによって、成長因子と協調して c-fos および c-jun を誘導します。翻訳過程におけるタンパク質合成の阻害剤です。また、ヒト単芽球細胞株 U937 においてアポトーシスを誘導することも知られています。						
Blasticidin S, Hydrochloride, *Streptomyces griseochromogenes*	589205	458.9	≥ 98% by HPLC	+4℃	H_2O (20 mg/ml) or Dilute Acetic Acid	203350-25MG	29,000
	ヌクレオシド系抗生物質。原核生物と真核生物の両方において、タンパク質合成を特異的に阻害します。本品は、ブラスチシジン S 耐性プラスミドと併用することで優性選択マーカーとして使用できます。ブラスチシジン S 耐性は、ブラスチシジン S を毒性のないデアミノヒドロキシ誘導体に変換するブラスチシジン S デアミナーゼ遺伝子（*bcr*）によって発現します。						
Chloramphenicol	56-75-7	323.1	≥ 97% by Assay	room temp.	Ethanol, Methanol (35 mg/ml), or H_2O (2.5 mg/ml)	220551-25GM	10,000
						220551-100GM	34,000
						220551-500GM	111,000
	合成静菌性抗生物質。リボソーム上でのペプチジルトランスフェラーゼ反応を抑制することによって、RNA からの翻訳を阻害します。						
Cycloheximide	66-81-9	281.3	≥ 90% by assay	room temp.	Chloroform, Ethanol, and Methanol	239763-1GM	11,000
						239763-5GM	19,000
	真核生物のタンパク質合成を阻害する抗真菌性抗生物質。原核生物においては阻害作用を示しません。hFBP12 を競合的に阻害します（K_i = 3.4 µM）。本品は、HL-60 細胞、T 細胞ハイブリドーマ、バーキットリンパ腫細胞、および他の細胞タイプにおいてアポトーシスを誘導します。						
Cycloheximide, High Purity	66-81-9	281.3	≥ 98% by HPLC	room temp.	Chloroform, Ethanol, and Methanol	239764-100MG	9,000
						239764-1GM	32,000
	抗真菌性抗生物質。病原性細菌に対しては、100 µg/ml の用量においても作用を及ぼしません。真核生物のタンパク質合成を阻害しますが、原核生物においては阻害作用を示しません。トランスロカーゼと直接相互作用することによって、転位ステップを阻害します。真核生物における無細胞系タンパク質合成を阻害します。hFKBP12 を競合的に阻害します（K_i = 3.4 µM）。HL-60 細胞、T 細胞ハイブリドーマ、バーキットリンパ腫細胞、および様々な他の細胞タイプ（齧歯類マクロファージなど）においてアポトーシスを誘導します。しかし本品は、Thapsigargin（製品番号 586005）、メチルプレドニゾロン、および Ionomycin（製品番号 407950 and 407952）で処理したラット胸腺細胞における DNA 切断を阻害します。アルカリ性溶液中で急速に分解します。						
InSolution™ Cycloheximide	66-81-9	281.3		+4℃		239765-1ML	16,000
	Cycloheximide（製品番号 239763）の溶液製品。						
Emetine, Dihydrochloride	316-42-7	553.6	≥ 98% by HPLC and Titration (dried basis) (perchloric acid method)	+4℃	Ethanol or H_2O (20 mg/ml)	324693-250MG	15,000
(6′,7′,10,11-Tetramethoxyemetan, 2HCl)	トコンの主要アルカロイド。*Uragoga ipecacuanha* の根から単離されたものです。mRNA に沿ったリボソームの移動を阻害することによって、真核生物におけるタンパク質合成を不可逆的にブロックします。アドレナリン受容体遮断作用によって低血圧を誘発します。早期 S 期における DNA 複製のサイトメトリー分析を妨げます。						
Erythromycin, *Streptomyces erythreus*	114-07-8	733.9	≥ 85% by HPLC	+4℃	Ethanol or Methanol	329815-5GM	9,500
						329815-25GM	27,000
(Erythromycin A)	抗菌剤。リボソームに結合することによって、細菌のタンパク質合成を阻害します。						
G 418 Sulfate, Cell Culture Tested	108321-42-2	692.7	≥ 98% by TLC	room temp.	Aqueous buffers or H_2O. Typically a stock solution of 10-50 mg/ml active drug is prepared in a highly buffered solution (e.g. 100 mM HEPES, pH 7.3, or cell culture medium).	345810-250MG	7,000
						345810-500MG	10,000
						345810-1GM	17,000
						345810-5GM	56,000
						345810-25GM	151,000
	原核細胞および真核細胞のタンパク質合成を阻害する、アミノグリコシド系ゲンタマイシン関連抗生物質。細菌、酵母、原生動物、蠕虫類、高等植物および哺乳類の細胞に対して毒性を示します。細菌 *neo′/kan′* が組込まれた遺伝子ベクターを発現させた真核細胞の選別に広く利用されています。この遺伝子の産物であるアミノグリコシド 3′- フォスフォトランスフェラーゼは、リン酸化により G418、ネオマイシンおよびカナマイシンを不活性化します。これらの遺伝子のいずれかを細胞に導入すると、G418 に対する耐性が獲得され、G418 を含んだ培地中での細胞の成長が可能になります。						
G 418 Sulfate, Sterile-Filtered Aqueous Solution, Cell Culture Tested	108321-42-2	692.7	≥ 98% by TLC	+4℃		345812-10ML	15,000
						345812-20ML	23,000
						345812-50ML	42,000
	製品番号 345810 の溶液。濾過滅菌済の活性抗生物質の 50 mg/mL 溶液。						
Hygromycin B, *Streptomyces sp.*	31282-04-9	527.5	>85% by HPLC	+4℃		400051-100KU	9,500
						400051-1MU	29,000
						400051-5MU	90,000
						400051-10MU	160,000
	ハイグロマイシンは、原核細胞（細菌）、真核微生物（酵母）および哺乳類細胞の発育を阻害する特異なアミノグリコシド系抗生物質です。タンパク質合成を 70S リボソームにおけるトランスロケーションにおいて阻害し、mRNA の誤読を引き起こします。*E. coli* 由来の *Hph* 遺伝子は、ハイグロマイシン B に対する抵抗性をコードし、組換え DNA 技術により分離およびクローン化されます。このハイグロマイシン B 抵抗性遺伝子は、様々な種類の細胞における組換えクローンの同定あるいは選別に特に有用です。ハイグロマイシン B はウイルス感染により浸透性となった細胞に侵入するので、有効な抗ウイルス薬として作用することができます。						

タンパク質合成 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Kanamycin Sulfate, *Streptomyces kanamyceticus*	25389-94-0	582.6		room temp.	H_2O (10 mg/ml)	420311-5GM	11,000
						420411-5GM	15,500
						420311-25GM	37,000
						420411-25GM	57,000
(Kamycin)	グラム陽性菌およびグラム陰性菌に対して効力を示すアミノグリコシド系抗生物質。30S リボソームに作用して遺伝子コードの誤読を引き起こす、タンパク質生合成阻害剤です。腎臓障害および耳毒性を引き起こすことがあります。						
Puromycin, Dihydrochloride	58-58-2	544.4	≥ 98% by TLC	-20℃	H_2O (50 mg/ml) and Methanol (20 mg/ml)	540222-25MG	8,500
						540222-100MG	27,000
[3′-(α-Amino-*p*-methoxyhydrocinnamamido)-3′-deoxy-N,N-dimethyladenosine, 2HCl]	タンパク質合成阻害物質。タンパク合成途中のペプチド鎖を未完成のまま放出させて翻訳を阻害します。胸腺細胞およびヒト HIL-60 白血病細胞内での DNA 断片化を誘導します。						
Puromycin, Dihydrochloride, Cell Culture-Tested	58-58-2	544.4	≥ 98% by TLC	-20℃	H_2O (50 mg/ml) and Methanol (20 mg/ml)	540411-25MG	9,000
						540411-100MG	24,000
	タンパク質合成阻害物質。タンパク合成途中のペプチド鎖を未完成のまま放出させて翻訳を阻害します。胸腺細胞およびヒト HIL-60 白血病細胞内での DNA 断片化を誘導します。						
RNA-Editing Ligase 1 Inhibitor, NSC 45208		590.48	≥ 95% based on elemental analysis	room temp.	DMSO (10 mg/ml) or H_2O (1 mg/ml)	557401-50MG	16,000
4,5-Dihydroxy-3-(1-naphthyldiazenyl)-2,7-naphthalenedisulfonic acid, disodium salt, dihydrate	スルホン酸化アゾ色素。relaxed complex scheme とバーチャルスクリーニング法により同定。RNA 編集リガーゼ 1 (REL1) の結合ポケットを作用標的として *T. brucei* のアデニル化活性を強力に阻害し、中等度の選択性を示します (TbREL1、バクテリオファージ T4 RNA リガーゼ 2 およびヒト DNA リガーゼ III b に対する IC_{50} はそれぞれ 1.95、3.53 および 27.49 μM)。						
Siomycin A, *Streptomyces sioyaensis*		1648.8	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (10 mg/ml)	567060-500UG	61,000
NSC 285116	RRNA 結合を干渉することで細菌性タンパク質合成 (IC_{50} = 250 nM) を阻害する細胞透過性チオストレプトン (製品番号 598226) ファミリーの大環状ペプチド抗生物質。転写活性 (IC_{50} ≤ 5 μM)、リン酸化反応、mRNA (10 μMde>60% 減少) やタンパク質量 (20 μM 時で >90% 減少) を負に制御することによって C3 細胞の哺乳類の FoxM1 (forkhead box M1) 機能を阻害することを示しています。非形質転換野生型細胞ではなく、SV40 転換 MRC-5 ヒト胎児肺線維芽細胞に選択的にアポトーシスを誘発します。						
Spectinomycin, Dihydrochloride, Pentahydrate, *Streptomyces sp.*	22189-32-8	495.4		+4℃	H_2O (50 mg/ml)	567570-10GM	31,000
	2 つのグルコース部分を含む抗菌スペクトルの広いアミノグリコシド抗生物質。フットプリント分析からは、スペクチノマイシンがリボソーム構造に対して局所的な効果を発揮することが示されています。なお、スペクチノマイシンをコードする耐性遺伝子 (*aph*) が、*Legionella pneumophila* (レジオネラ症の病原体) キナーゼからクローニングされ、大腸菌内で発現されています。						
Streptomycin Sulfate, *Streptomyces sp.*	3810-74-0	1457.7		room temp.	H_2O (50 mg/ml) . Autoclaved media should be cooled to ≤ 55℃ before adding streptomycin.	5711-100GM	14,000
	グラム陽性およびグラム陰性のバクテリアに対して効果的な抗生物質。微生物の増殖を制御するために、培養培地中で使用されます。原核生物におけるタンパク質合成の開始、伸長および終結を阻害し、遺伝コードの誤読を誘導します。						
Tetracycline, Hydrochloride	64-75-5	480.9		room temp.	Ethanol (5 mg/ml) or H_2O (20 mg/ml)	58346-10GM	6,500
						58346-25GM	9,500
						58346-50GM	16,000
	リボソームの A サイトにアミノアシル tRNA が結合するのを阻害することにより、タンパク質の合成を阻害する広域的抗生物質。バクテリアでコールドショック反応を誘導し、P450 の発現量を高めます。						
Thiostrepton	1393-48-2	1664.8	≥ 98% by TLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or Chloroform (10 mg/ml)	598226-1GM	20,000
						598226-10GM	113,000
	50S リボゾームサブユニットに GTP が結合するのを防ぐことによって、タンパク質合成を阻害するチアゾール含有ペプチド抗生物質。延長因子 G (EF-G) の機能およびリボソームからの EF-G の解離を阻害します。また、チオストレプトン耐性遺伝子は、組換え DNA およびプラスミドの選択マーカーとしても広く用いられています。						
Tobramycin, Free Base	32986-56-4	467.5		room temp.	H_2O	614005-100MG	12,000
	アミノグリコシド抗生物質。ミエロペルオキシダーゼ依存性の酸化細胞傷害を抑制します。						

幹細胞

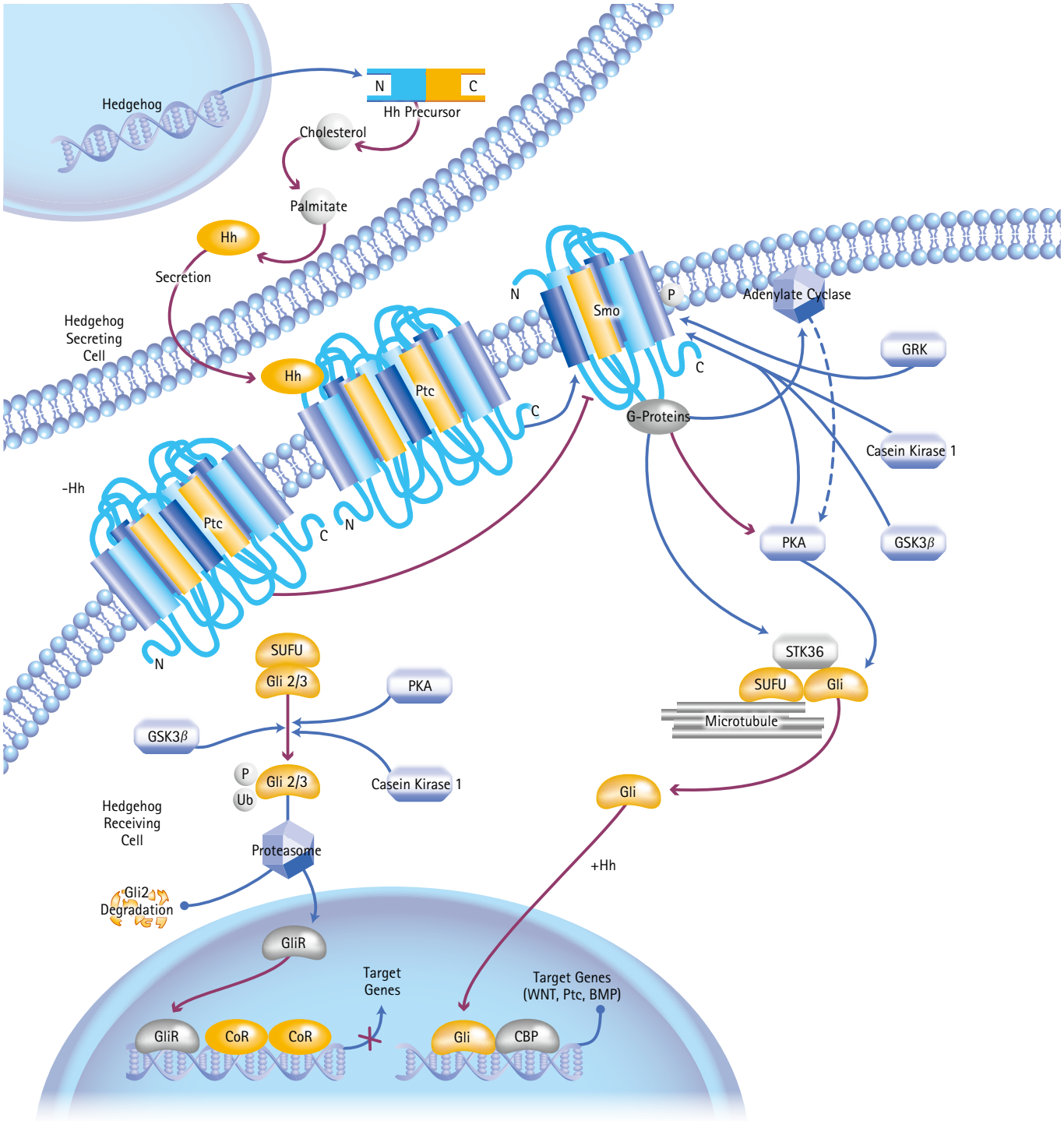
Sonic Hedgehog Signaling 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
βARK1 Inhibitor		263.2	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (5 mg/ml) or Methanol	182200-5MG	28,900
{β-Adrenergic Receptor Kinase1 Inhibitor; GRK2 Inhibitor; Methyl 5-[2-(5-nitro-2-furyl)vinyl]-2-furoate}	βARK1 (β-Adrenergic Receptor Kinase 1) の選択的阻害剤 (IC_{50} = 126 μM)。プロテインキナーゼ A (PKA) には影響しません。						
AY 9944	366-93-8	464.3	≥ 95% by HPLC	+4℃	H_2O (20 mg/ml) or DMSO (20 mg/ml)	190080-5MG	25,000
[*trans*-1,4-*bis*(2-Chlorobenzylaminomethyl) cyclohexane, 2HCl; Shh Signaling Antagonist IV]	コレステロール生合成およびそのエステル化を阻害する細胞透過性の両親媒性ジアミン。7- デヒドロコレステロールリダクターゼ (D7- ステロールリダクターゼ) 活性を特異的にブロックします。Sonic Hedgehog シグナリングおよび催奇形性の研究における重要なツールとなります。また、繊維芽細胞において酸性スフィンゴミエリナーゼ活性の迅速かつ不可逆的な低下を誘導することが報告されています。						
Betulinic Acid	472-15-1	456.7	>97% by HPLC	+4℃	DMSO (1 mg/ml)	200498-5MG	31,900
[3β-Hydroxy-20(29)-lupaene-28-oic Acid]	抗腫瘍・抗 HIV 剤。本品は、細胞培養および動物モデルにおいてヒトメラノーマを選択的に阻害する、五環系トリテルペンです。他のタイプの腫瘍に影響を及ぼさずにメラノーマ細胞に対して特異的に作用します。ベツリン酸の抗腫瘍作用は、アポトーシスの引き金となるミトコンドリア透過性遷移孔の誘導に関連していると思われます。						
Cyclopamine, *V. californicum*	4449-51-8	411.6	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO (4 mg/ml), Ethanol (5 mg/ml), or DMF (10 mg/ml). Ethanol stock solutions may require warming to achieve complete solubilization.	239803-1MG	33,900
(Shh Signaling Antagonist I)	ステロイド系アルカロイドの擬コレステロール化合物で、teratogenic 活性と抗腫瘍活性を示します。コレステロールの生合成を妨害し、shh (Sonic Hedgehog) シグナル伝達経路のアンタゴニストとして G タンパク質共役受容体の類縁分子 Smo (smoothened) と直接作用します。種々がんにおける Shh シグナル研究の有用なツールです。 Tomatidine (製品番号 614350) をネガティブコントロールとしてご利用ください。						
Cyclopamine-KAAD		698	≥ 70% by HPLC (sum of two isomers)	-20℃	DMSO (5 mg/ml), Ethanol (1 mg/ml), or Methanol (1 mg/ml)	239804-100UG	35,900
						239804-500UG	145,000
[KAAD-Cyclopamine; 3-Keto-N-(aminoethyl-aminocaproyl-dihydrocinnamoyl)cyclopamine; Shh Signaling Antagonist II]	Cyclopamine (製品番号 239803) の強力なアナログ。同様もしくはより低い毒性で Hedgehog (Hh) シグナリングを特異的に阻害します (Shh-LIGHT2 アッセイにおける IC_{50} = 20 nM; $p2^{Ptch-/-}$ 細胞では 50 nM; SmoA1-LIGHT 細胞では 500 nM)。SmoA1 に結合し、小胞体からの排出を促進します。ShhNp が誘導する経路活性および SmoA1 が誘導するレポーター活性を両方とも抑制します。						
InSolution Cyclopamine-KAAD		698	≥ 70% by HPLC (sum of two isomers)	-70℃		239807-50UG	18,900
Hh Signaling Antagonist XIV, SANT-2	329196-48-7	480	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml) or Ethanol (25 mg/ml)	373273-10MG	32,000
N-[3-(1H-Benzimidazol-2-yl)-4-chlorophenyl]-3,4,5-tris(ethyloxy)benzamide, Smo Antagonist V	HEK293 ベースの (Shh-LIGHT2) レポーターアッセイにおいて、ShhNp ならびに SAG 刺激ヘッジホッグ経路活性を拮抗するのに、SANT-1 (製品番号 559303) と比べて生物活性がそれぞれ 2 ～ 3 倍、および 6 倍弱いことを示すナノモル Smoothened (smo) 拮抗薬。競合的結合の研究で、SANT-1 ならびに SANT-2 ((K_i = それぞれ 2.4 ならびに 8.4 nM) による Smo 結合シクロパミン (製品番号 239803) の完全置換を示しています。一方、SANT-1 ならびに SANT-2 はアロステリックに Smo 結合 SAG-1.3 (製品番号 566660 & 566661) に対して競合するので、SANT-1 ではなく SANT-2 のみが完全に off bound SAG-1.3 (10 μM 時で各化合物による置換 100% vs. 40%) 競合することができることを示しています。						
Hh Signaling Antagonist XII, HPI-1	599150-20-6	463.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml)	373275-10MG	27,000
2-Methoxyethyl-4-(3-hydroxyphenyl)-7-(2-methoxyphenyl)-2-methyl-5-oxo-4,6,7,8-tetrahydro-1H-quinoline-3-carboxylate	ふたつの別のダウンストリームブロッキング剤 HPI-3 (製品番号 373276) と GANT-61 (製品番号 373401) と同様の方法で *Sufu*$^{+/+}$NIH 3T3 (shh-LIGHT2) ならびに *Sufu*$^{-/-}$ 線維芽細胞培養 (IC_{50} = 1.5 & 3 μM、respectively) の Gli 依存性転写活性を効果的に阻害することでダウンストリーム Hh (ヘッジホッグ) 経路ブロッキング剤として働く細胞透過性のオキソ - テトラヒドロキノリンカルボン酸塩化合物。しかし、HPI-3 や GANT-61 (no effect at 30 μM) ではなく、HPI-1 だけは、*Sufu*$^{-/-}$ fibroblasts overexpressing Gli1 や Gli2 (IC_{50} = 6 & 4 μM、respectively) に対して効果があります。HPI-1 もまた、SmoM2 発現初代マウス CGNP (Cerebellar Granule Neuron Precursors) ならびに NIH 3T3 (smoM2-LIGHT) 培養の阻害を示します。						
Hh Signaling Antagonist XIII, HPI-3	796887-98-4	349.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	373276-10MG	23,000
2-((-(4-Phenylpiperazin-4-yl)quinazolin-4-yl)amino)ethanol	他の 2 つの Hf ダウンストリームブロッキング剤の HPI-1 (製品番号 373275) ならびに GANT-61 (製品番号 373401) と同様に、Sufu$^{+/+}$ NIH 3T3 (shh-LIGHT2) ならびに Sufu$^{-/-}$ 線維芽細胞培養 (IC_{50} = それぞれ 3 & 9 μM) の両方において Gli 依存性転写活性を効果的に阻害する Hr (ヘッジホッグ) 経路ブロッキング剤として働く細胞透過性のピペラジニルキナゾリン化合物。しかし、HPI- 1 とは異なり、Su (fu)$^{-/-}$ 線維芽細胞に対する HPI-3 の阻害活動は、Gli1 あるいは Gli2 の過剰発現によって完璧に破壊されます。HPI-1 と HPI-3 は両方とも SmoM2 発現 NIH 3T3 培養 (IC_{50} = それぞれ 2.5 & 1 μM) におけるリガンド非依存性 Hf 経路活性を阻害することを示していますが、HPI-3 ではなく HPI-1 のみが初代マウス CGNPs (小脳顆粒神経細胞前駆体) 培養の SmoM2 誘発の Hh 経路活性を効果的に抑制することができます。						
Hh Signaling Antagonist VII, JK184	315703-52-7	350.4	≥ 98% by HPLC	-20℃	DMSO (40 mg/ml) or Methanol (10 mg/ml)	373385-5MG	21,900
N-(4-Ethoxyphenyl)-4-(2-methylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)thiazol-2-amine	細胞透過性のイミダゾピリジン化合物。Gli 依存性転写活性を阻害し (トランスフェクション C3H10T1/2 細胞における IC_{50} = 30 nM)、Gli および Ptc1 の発現レベルを低下させます。Hh 活性化腫瘍細胞において成長停止を選択的に誘導し (Gi_{50} 約 3-21 nM)、異種移植マウスモデルにおいて腫瘍成長を抑制します (0.2 mg/mouse/day、強制経口投与)。クラス IV アルコールデヒドロゲナーゼ (Adh7) に作用し (K_d = 348 nM)、その活性を阻害することが知られています。						

Sonic Hedgehog Signaling 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Hh/Gli Antagonist, GANT58	**64048-12-0**	**392.5**	**≥ 95% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO（10 mg/ml）**	**373400-5MG**	**37,900**
4-(2,4,5-Tri(pyridin-4-yl) thiophen-3-yl) pyridine	細胞透過性のテトラピリジニルチオフェン化合物。下流 Hedgehog（Hh）経路ブロッカーとして作用し、Gli を介した遺伝子転写活性化をターゲットとします（SAG 刺激 Shh-L2 細胞における IC_{50} = 約 5 μM）。その作用は Smo および Sufu の下流の Hh 経路特異的であると思われますが、Gli DNA 結合は妨げないと思われます。Hh ターゲット遺伝子、*Gli1*、*Hip1* および *Ptch* の細胞内 mRNA レベルを低下させ、*in vitro* と *in vivo* の両方において Gli 依存性腫瘍増殖を抑制することが知られています。						
Hh/Gli Antagonist, GANT61	**500579-04-4**	**429.6**	**≥ 95% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO（5 mg/ml）or Ethanol（5 mg/ml）**	**373401-5MG**	**37,900**
2-((3-(2-(Dimethylamino) benzyl)-2-(4-pyridinyl) tetrahydro-1(2H)-pyrimidinyl) methyl)-N,N-dimethylaniline	抗腫瘍作用を示す細胞透過性のヘキサヒドロピリミジン化合物。Gli のレベルで Smo および Sufu の下流における Hedgehog シグナル伝達を阻害し（Smo アゴニスト処理 Shh-L2 細胞における IC_{50} = 約 5 μM）、5 μM で PANC1 および 22Rv1 癌細胞における Gli および Ptch の発現レベルを著しく抑制します。Gli-DNA 結合を選択的に破壊し、Gli1 および Gli2 誘導性の転写を抑制します（トランスフェクション HEK293 細胞における IC_{50} = < 10 μM および < 30 μM）。						
Hedgehog Antagonist VIII	**330796-24-2**	**490.8**	**≥ 95% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO（100 mg/ml）**	**373402-5MG**	**42,000**
1-(4-Chloro-3-(trifluoromethyl) phenyl)-3-((3-(4-fluorophenyl)-3,4-dihydro-4-oxo-2-quinazolinyl) methyl)-urea,	細胞透過性のキナゾリニル尿素化合物。10t 1/2（s12）細胞を用いたルシフェラーゼレポーターアッセイにおいて OCT-Shh により刺激される Gli 転写活性を強力に阻害することが報告されています（IC_{50} = 70 nM）。						
Jervine	**469-59-0**	**425.6**	**≥ 98% by HPLC; single spot by TLC**	**-20℃**	**DMSO（5 mg/ml）or Ethanol（10 mg/ml）. Slight warming may be required to achieve complete solubilization in ethanol.**	**420210-1MG**	**26,000**
[(3β, 23β)-17,23-Epoxy-3-hydroxyveratraman-11-one; 11-Ketocyclopamine; Shh Signaling Antagonist III]	Cyclopamine（製品番号 239803）に類似した細胞膜透過性のステロイダルアルカロイド。催奇性効果を示し、shh（Sonic Hedgehog）シグナリングをブロックすることによって単眼症を誘導します（S12 細胞における IC_{50} = 約 500-700 nM）。ネガティブコントロールとして Tomatidine（製品番号 614350）があります。						
Purmorphamine		**520.6**	**≥ 95% by HPLC**	**+4℃**	**DMSO（200 mg/ml）**	**540220-5MG**	**39,900**
[2-(1-Naphthoxy)-6-(4-morpholinoanilino) -9-cyclohexylpurine; Shh Signaling Antagonist VI]	細胞透過性の 2,6,9- 三置換プリン化合物。多能性間葉前駆細胞 C3H10T1/2（EC_{50} = 1 μM）および系列決定済み前骨芽細胞 MC3T3-E1 から骨芽細胞への分化を誘導します。BMP-4（骨形成タンパク質 -4）と相乗的に作用し、前脂肪細胞および筋芽細胞においても分化転換を誘導することが明らかになっています。Hedgehog シグナル伝達経路の活性化によって骨形成を誘導することが報告されています。						
SANT-1	**304909-07-7**	**373.5**	**≥ 98% by HPLC**	**-20℃**	**DMSO（5 mg/ml）**	**559303-5MG**	**29,900**
(Shh Signaling Antagonist V)	Smoothened（Smo；K_d =1.2 nM）と直接結合する、Sonic Hedgehog（Shh）シグナリング経路の強力なアンタゴニストです [$Ptch1^{-/-}$ 細胞を用いた Shh-LIGHT2 分析法では IC_{50}=20 nM]。Smoothened は G タンパク質共役受容体と多少関係しています。						

Hedgehog Signaling Cascade



Sonic Hedgehog Signaling 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Smoothened Agonist, SAG [N-Methyl-N'-(3-pyridinylbenzyl)-N'-(3-chlorobenzo[b]thiophene-2-carbonyl)-1,4-diaminocyclohexane; $SAG_{1.3}$]	364590-63-6	599	≥ 90% by TLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml) or H_2O (25 mg/ml)	566660-1MG	47,900
	細胞透過性のベンゾチオフェン化合物。Shh-LIGHT2 細胞において EC_{50} 約 3 nM でヘッジホッグシグナル伝達経路を活性化し、Cyclopamine (製品番号 239803) 作用を拮抗します。Smoothened に直接結合し (Smo 発現 Cos-1 細胞における K_{dapp} = 59 nM)、Gli 転写活性を誘導します。						
Tomatidine, HCl	6192-62-7	452.1	≥ 95% by TLC	+4℃	DMSO (2 mg/ml), Ethanol (2.5 mg/ml), DMF (2 mg/ml), or Methanol:Chloroform (1:1, 50 mg/ml). Slight warming may be required to achieve complete solubilization.	614350-25MG	13,000
	Cyclopamine (製品番号 239803) に類似した構造のステロイド系アルカロイドですが、shh (Sonic Hedgehog) シグナル伝達の阻害能がありません。催奇形性がないことが報告されています。						
U18666A [3β-(2-Diethylaminoethoxy)androst-5-en-17-one, HCl]	3039-71-2	424.1	≥ 98% by HPLC	+4℃	H_2O (10 mg/ml)	662015-10MG	26,900
	細胞透過性の両イオン性アミノステロイド。細胞膜のタンパク質透過性を阻害します。おそらく 2,3- オキシドスクアレン - ラノステロール シクラーゼ活性を阻害することで、細胞内の LDL 由来コレステロールの生合成と移送を阻害します。また、δ8- ステロールイソメラーゼ活性も阻害します。						

Wnt シグナリング 阻害剤

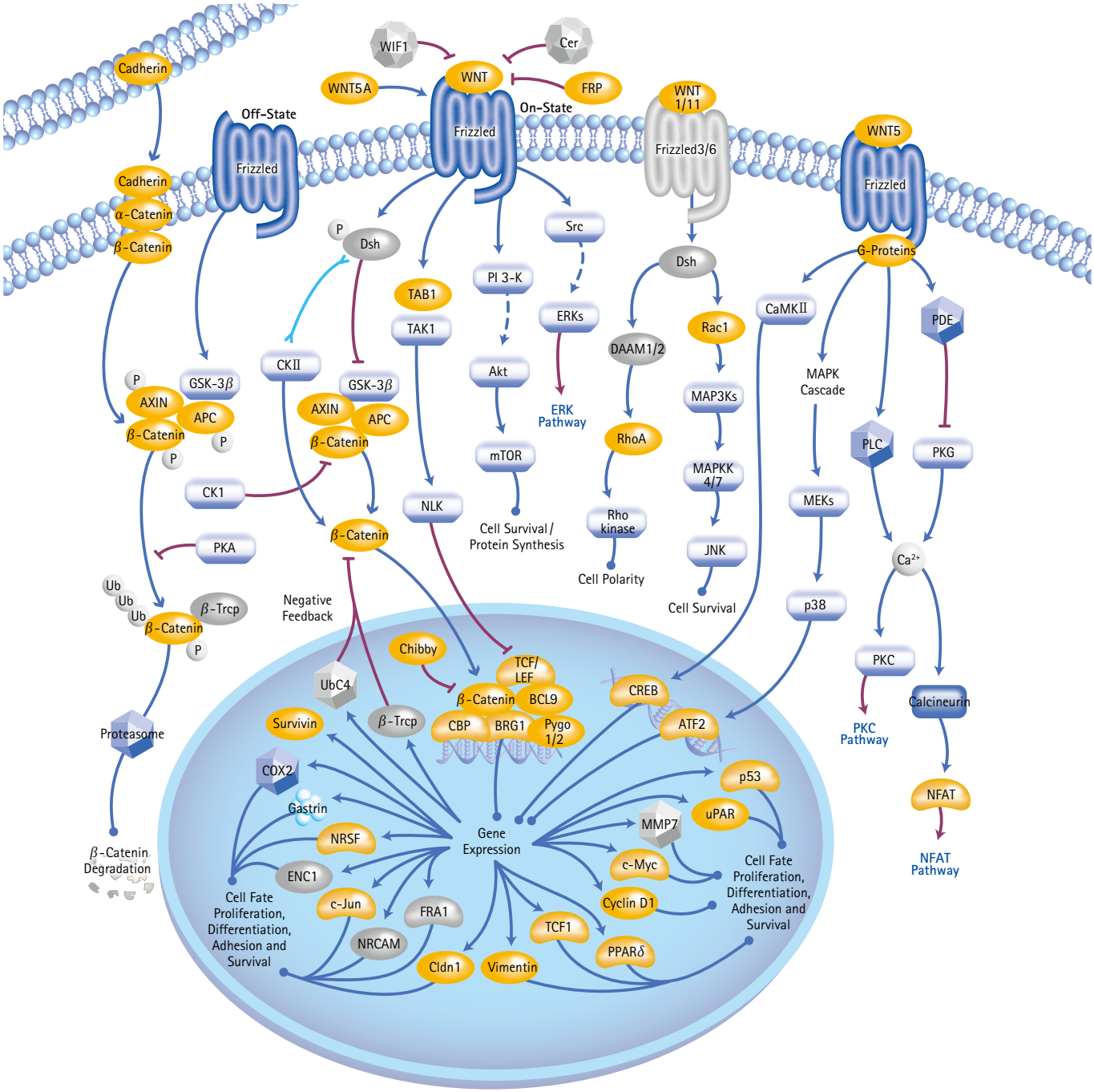
	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
β-Catenin/Tcf Inhibitor, FH535 N-(2-Methyl-4-nitro)-2,4-dichlorosulfonamide	108409-83-2	361.2	≥ 94% by HPLC	+4℃	DMSO (100 mg/ml)	219330-10MG	21,900
	細胞透過性を有するスルフォンアミド化合物。Wnt/β- カテニンおよび PPARγ/δ シグナリングを可逆的に抑制します。PPARγ および PPARδ への β- カテニン動員および GRIP1 動員を阻害し、Tcf4 転写を阻害しますが、β- カテニンレベルには影響を及ぼしません。Wnt/β- カテニン活性型癌細胞に対して選択的毒性を示します (LC_{50}=5 ～ 15 μmol/L)。						
β-Catenin/Tcf Inhibitor II, PKF118-310		193.2	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO	219331-10MG	38,900
β-catenin/Tcf inhibitor III, iCRT3		394.5	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	219332-10MG	29,900
Dvl-PDZ Domain Inhibitor II 2-((3-(2-Phenylacetyl)amino)benzoyl)amino) benzoic acid	294891-81-9	374.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	322338-10MG	13,900
	Dvl の PDZ ドメイン (K_d= 10.6 μM) を標的にし、Wnt3a 誘因 (10 ng/ml) の転写活性 (293 細胞 SuperTopflash レポーターアッセイにおいて 3 μM 時に ~50% 阻害) を阻害し、前立腺癌 PC-3 細胞の Wnt 経路依存性増殖を抑制する (≥ 50 μM、IC_{50} = 12.5 μM で 72 h のとき 16%) ことで Fz-Dvl (frizzled-dishevelled) 相互作用を分離する細胞透過性アミドベンズアニリド化合物。Wnt3A mRNA 注水誘発の *xenopus* 胚変形 (効果的な conc. = 25 μM) を効果的に防ぎ、硝子体注射 (144 fmol/120 nl/eye) *in vivo* を通じてマウスの目に硝子体血管系内皮細胞の Wnt 経路介在アポトーシスを抑制することを示しています。						
sFRP Inhibitor II	302804-57-5	355.4	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO	344301-10MG	20,900
GW9662 (2-Chloro-5-nitro-N-phenylbenzamide)	22978-25-2	276.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (20 mg/ml) or Methanol	370700-5MG	16,900
	細胞透過性を有する選択的かつ不可逆的な PPARγ アンタゴニスト [IC_{50} = 3.3 nM (PPARγ)、32 nM (PPAR α)、2 μM (PPARδ)]。PPAR 結合部位のシステイン残基を共有結合的に修飾することが報告されています。10 μM の濃度では、ヒトのプレグナン X 受容体 (PXR) およびファルネソイド X 受容体 (FXR) のアゴニストとしても作用します。肝臓 X 受容体 α (LXR $_\alpha$)、レチノイン酸受容体 (RAR)、レチノイド X 受容体 α (RXR $_\alpha$)、ならびに甲状腺受容体 α および β (TR $_\alpha$および TR $_\beta$) の活性化作用は示しません。						
IQ-1 2-(4-Acetylphenylazo)-2-(3,3-dimethyl-3,4-dihydro-2H-isoquinolin-1-ylidene)-acetamide	331001-62-8	362.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	412400-10MG	43,900
	細胞透過性のテトラヒドロイソキノリニリデン化合物。マウス胚幹細胞 (ESC) を Wnt 依存的に選択的に未分化状態に維持します。PP2A フォスファターゼの PR72/130 サブユニットに結合して p300-Ser^{89} リン酸化および p300/β カテニン相互作用を低下させ、β カテニン /CBP 誘導性の転写を促進します。また、Nanog の発現レベルを上昇させ、c-myc を低下させます。						
Smoothened Agonist, SAG	364590-63-6	599	≥ 98% by HPLC	+4℃	DMSO or H_2O	566660-5MG	180,900
Tankyrase1/2 Inhibitor, XAV939		312.3	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO	575545-10MG	29,900
Wnt Synergist, QS11 Wnt Pathway Activator II	944328-88-5	567.7	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (50 mg/ml) or Ethanol (20 mg/ml)	681668-5MG	41,900
	細胞透過性のプリン化合物。Wnt の特異的な相乗剤として作用し、Wnt/β- カテニンシグナル伝達経路 (Super (8X) TOPFlash-HEK293 細胞における EC_{50} = 500 nM) および *Xenopus* 発生を活性化します。また、BIO, GSK-3 Inhibitor IX (製品番号 361550) の相乗剤として作用します。ARFGAP1 (ADP リボシル化因子 1 の GTPase 活性化タンパク質) に高い親和性 (K_d= 620 nM) で直接結合し、ARF (ADP リボシル化因子) の活性化および β- カテニンのトランスロケーションを誘導します。MDA-MB-231 細胞の移動を 2.5 μM で 86% 抑制することが知られています。						

幹細胞

Wnt シグナリング 阻害剤

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格(¥)
Wnt Antagonist I, IWR-1-endo		409.4	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (10 mg/ml)	681669-10MG	30,900
	細胞透過性 *p* - イミノベンズアミドキノリンの *endo* 型ジアステレオマー。*in vitro* 自己ポリ ADP リボシル化（auto-PARsylation）アッセイにおいて TNKS1/PARP5a および TNKS2/PARP5b の活性を阻害し（IC_{50} = 131 および 56 nM）、また L-Wnt-STF 細胞を用いたレポーターアッセイにおいて Wnt- 刺激転写活性を効果的に阻害するものの（IC_{50} = 180 nM）、PARP1 や PARP2 に対してはほとんど阻害活性を示さないことが判明しています（IC_{50} >18.75 µM）。IWR-1-endo と XAV939（製品番号 575545）はいずれも Wnt 経路の可逆的阻害剤として作用し、*in vitro* でも *in vivo* でもほぼ同様の薬理作用を示すものの、IWR-1-endo が Axin との相互作用を介して作用を発揮するのに対し、XAV939 は TNKS と直接結合する点が異なります。						
Wnt Antagonist II, IWP-2	686770-61-6	466.6	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO (2.5 mg/ml)	681671-10MG	35,900
	細胞透過性のベンゾチアゾリル - アセトアミド化合物。MBOAT（膜結合性 O- アシルトランスフェラーゼ）ファミリーに属する Porcn-（Porcupine）による Wnt のパルミチン酸化を選択的に阻害することにより、細胞における Wnt のプロセシングと分泌を阻害します。IWP-2 は一般に Wnt/β カテニンシグナル伝達経路には影響を及ぼさず、Wnt の刺激を受けて生じる細胞応答にも全く作用を示しません。						
Wnt/β-catenin Inhibitor, Cardamonin	19309-14-9	270.28	≥ 95% by HPLC	-20℃	DMSO (100 mg/ml) or Ethanol (5 mg/ml)	681672-2MG	17,900
(E)-1-(2,4-dihydroxy-6-methoxyphenyl)-3-phenylprop-2-en-1-one	2,4- ジヒドロキシ -6- メトキシカルコンとして知られる cardamonin は、その他多くの薬理学活動の中で、細菌メラニン細胞分化の阻害剤としても確認されました。cardamonin は、MITF とチロシナーゼの発現を下方制御することでメラニン形成を抑制しながら、細胞内の β- カテニンの分解を促進し、結果的にメラニン含有量が減少しました。さらに、cardamonin が GSK-3β 非依存性メカニズムにより β- カテニンの分解を促進することが明らかになりました。これは、GSK-3β- 依存性経路ではなく、Siah 依存性経路および／または PKCα- 依存性経路が cardamonin による細胞内の β- カテニンの分解を仲介していることを示唆しています。						
Wnt Antagonist III, Box5		766.9	≥ 90% by HPLC	-20℃	DMSO (50 mg/ml) or H_2O (4 mg/ml)	681673-10MG	37,900
Boc-MDGCEL-OH	遊走、浸潤、カルシウム反応、MARCKS リン酸化を含む 2058 ならびに HTB63 メラノーマ培養での Wnt-5a 介在細胞活性を効果的に中和する Wnt-5a- 由来の N 末端ブチルオキシカルボニル（Boc）保護のヘキサペプチド。N 末端 Boc をホルミル修飾へ置換することは、Frizzled-5-（Fzd-5/Frz-5）依存的に Wnt-5a 生物活性を中和する代わりに擬態する Foxy5 と呼ばれるペプチドとなります。このペプチド配列は、ヒト、マウス、ラットを含む多様な種の中で保存されており、また Box5 は、Foxy5 の場合と同じように、直接の FZD5 結合を通じてその効果を示すと期待されています。						
Wnt Antagonist III, CCT036477	305372-78-5	347.84	≥ 95% by 1H NMR	+4℃	DMSO (50 mg/ml)	681674-5MG	21,900
CCT036477	Wnt シグナリングの阻害剤として働く細胞透過性の誘導体はレポーター細胞株（IC_{50} = 4.6 µM）において阻害効果を示し、β- カテニン蓄積を置換するのではなく β- カテニンレベルで転写をブロッキングすることにより多様ながん細胞株の成長阻害を示します。Myc ならびにサバイビンルシフェラーゼレポーターアッセイにおいて Wnt 標的遺伝子の発現を低減し、20 µM でゼブラフィッシュ、75 µM でアフリカツメガエル胚の発達をブロッキングすることによって *in vivo* 活性を示します。						
Wnt Pathway Inhibitor XII, 21H7		384.2	≥ 97% by HPLC	+4℃	DMSO	681679-10MG	24,900

WNT Signaling



幹細胞

その他

	CAS 番号	MW	Purity	Strage	Solubility	カタログ番号	希望販売価格（¥）
Reversine [2-（4-Morpholinoanilino）-6-cyclohexylaminopurine]	656820-32-5	393.5	≥ 95% by HPLC	+4℃	DMSO（2.5 mg/ml）	554717-5MG	39,900
脱分化誘導剤として作用する、細胞透過性の 2,6- 二置換プリンアナログ。1 - 10 µM の濃度範囲でマウス C2C12 筋芽細胞から多能性間葉前駆細胞への脱分化を誘導することが明らかになっています。細胞分化過程を逆転させることが確認された最初の有機分子です。							
Hh Signaling Pathway Modulators				-20℃		373386-1EA	277,000
Hh（ヘッジホッグ）シグナリング経路の研究に役立つ、有効で選択的、細胞透過性の拮抗薬、阻害剤ならびに作動薬 14 種類を含むパネル：βARK1 阻害剤（5 mg、製品番号 182200）、シクロパミン -KAAD（100 µg、製品番号 239804）、フラバスタチン（25 mg）、ナトリウム塩（製品番号 344095）、GSK-3 阻害剤 IX（1 mg）；BIO（製品番号 361550）、H-89（1 mg）、二塩酸塩（製品番号 371963）、Hh シグナリング拮抗薬 XIV（10 mg）；SANT-2（製品番号 373273）、Hh シグナリング拮抗薬 XII（10 mg）；HPI-1（製品番号 373275）、Hh シグナリング拮抗薬 XIII（10 mg）；HPI-3（製品番号 373276）、Hh/Gli 拮抗薬（5 mg）；GANT61（製品番号 373401）、Hh シグナリング拮抗薬 VII（5 mg）；JK184（製品番号 373385）、IC261（5 mg、製品番号 400090）、MG-132（5 mg、製品番号 474790）、パルモルファミン（5 mg、製品番号 540220）Smoothened 作動薬（1 mg）；SAG（製品番号 566660）無水 DMSO（製品番号 KP31817）15ml、データシートもご提供いたします。							
Pluripotin N-（3-（7-（1,3-dimethyl-1H-pyrazol-5-ylamino）-1-methyl-2-oxo-1,2-dihydropyrimido[4,5-d] pyrimidin-3（4H）-yl）-4-methylphenyl）-3-（trifluoromethyl）benzamide		550.5	≥ 97% by HPLC	-20℃	DMSO（50 mg/ml）	540020-1MG	19,900
GTP- 結合の活性 Ras レベルを効果的に上方修正し、細胞 STAT3 あるいは GSK-3 β/Wnt シグナリングに影響を及ぼすことなく、Erk と RasGAP（K_D = それぞれ 212 ならびに 98 nM、RasGAP 729-1042 触媒ドメイン Erk1 を結合）との直接的な相互作用と通じ、OG2-mES（マウス胚幹細胞）細胞（1 µM）における LIF-（白血病抑制因子）誘発 Erk1/2 リン酸化反応を阻害する細胞透過性ジヒドロピリミド - ピリミジン化合物。Pluripotin/SC1 は複数のマウス株の胚盤胞から ESC を導き出すことにおいて LIF の効率性を大いに補完して高め、培養における 11 継代後でさえ ESC の pluripotent 状態を効果的に保ちます。SC1 膨張 ESC は SC1 ならびに LIF をやめるとき効果的に EB（胚体）*in vitro* を形成し、別の株 *in vivo* から胚盤胞へ注入したとき代理マウスからキメラ個体を精製することができます。							

ご注文に際して

■ 問い合わせ

製品についてのお問い合わせは弊社テクニカルサポート、または弊社製品販売店までご連絡ください。

Tel：0120-633-358　　Fax：03-5434-4859
On-Line：www.millipore.com/jpts

■ 注文

ご注文は弊社製品販売店にご連絡ください。

■ 価格

本カタログの記載価格は、2014 年 1 月 1 日現在の価格です。諸般の事情により、価格が予告なく変更となる場合がありますので、あらかじめご了承ください。

■ 製品保証

本カタログ記載の製品は、データシートの規格を保証します。規格は予告なく変更となる場合がありますので、あらかじめご了承ください。特記なき場合、製品の保証期間は 1 年となります。

■ 使用目的

本カタログ記載の製品はすべて研究用です。ヒト・動物への治療、もしくは診断目的など、研究以外の用途には試用できません。

■ 返品・交換

弊社からの誤送、梱包の不備、製品の破損、および品質上問題がある場合を除き、返品・交換はご容赦願います。

■ バルク販売

一部の製品を除き、目安として標準製品の 30 倍量程度からバルク販売が可能です。詳細につきましては、弊社テクニカルサービスまたは弊社製品販売店までご相談ください。

■ カタログ記載内容

本カタログ記載の製品は、2014 年 1 月 1 日現在のものです。諸般の事情により製品、包装サイズおよびキット内容を予告なしに削除・変更する場合がありますので、あらかじめご了承ください。

■ SDS

安全データシート（SDS）をご希望の方は、弊社製品販売店または弊社カスタマーサポートまでお問い合わせください。製品ラベルには、毒物および劇物取締法や消防法など、法的規制品目に当該製品が抵触するかどうかを表示していますが、取り扱いには充分ご注意ください。

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
5HPP-33	124
7BIO	56
17bHydroxysteroidDehydrogenasetype3Inhib	15
1400W	128
A	
A77 1726	53
A317491	13
A 438079	13
A740003	13
a-(Methylamino)isobutyric Acid	13
AACOCF3	116
17-AAG	110
ACA	116
ACC2 Inhibitor, CD-017-0191	118
ACEA	11
Acetyl-11-keto-β-Boswellic Acid, Boswellia serrata	100
Acetyl-Pepstatin	23
Acidic Mammalian Chitinase Inhib, Bisdionin	15
Actinomycin D, 7-Amino-	93
Actinomycin D, *Streptomyces sp.*	93
AdaAhx3L3VS	21
ADAMTS-5 Inhibitor	18
Adenosine 3', 5'-cyclic Monophosphorothioate, 2'-O-Monobytyryl	48
Adenosine 3', 5'-cyclic Monophosphorothioate, 8-Chloro-, Rp-Isomer, Sodium Salt	48
Adenosine A2A Receptor Antagonist II SCH58261	11
Adenosine A2A/A1 Receptor Antagonist	11
Adenosine A3 Receptor Antagonist, MRS 1523	11
Adenosine Deaminase Inhibitor, DCF	15
Adenosine Kinase Inhibitor	73
Adenylyl Cyclase Type V Inhibitor, NKY80	106
ADP-HPD, Dihydrate, Ammonium Salt	131
AEBSF, Hydrochloride	23
AF353	13
AF-DX 116	13
InSolution™ AG490	61
AG 9	60
AG 17	61
AG 18	60
AG 82	60
AG 126	43
AG 490, m-CF3	61
AG 490	60
AG 538	61
AG 825	53
AG 879	61
AG 1024	53
AG 1295	61
AG 1296	61

製品名	ページ
AG 1478	61
InSolution™ AG 1478	61
AhR Agonist V, VAF347	11
AhR Antagonist	74
AhR Antagonist III, GNF351	11
AIDA 1 PC X 5 MG	13
AKR1C1 Inhibitor, 5-PBSA	133
AKR1C3 Inhibitor	15
Akt Activator II, SC79	11
Akt Inhibitor	30
Akt Inhibitor II	30
Akt Inhibitor III	30
Akt Inhibitor IV	30
InSolution™ Akt Inhibitor IV	30
Akt Inhibitor IX, API-59CJ-OMe	30
Akt Inhibitor V, Triciribine	30
InSolution™ Akt Inhibitor V, Triciribine	31
Akt Inhibitor VI, Akt-in	30
Akt Inhibitor VII, TAT-Akt-in	30
Akt Inhibitor VIII, Isozyme-Selective, Akti-1/2	30
InSolution™ Akt Inhibitor VIII, Isozyme-Selective, Akti-1/2	30
Akt Inhibitor X	30
Akt Inhibitor XI	30
Akt Inhibitor XII, Isozyme-Selective, Akti-2	30
Akt Inhibitor XIII, Isozyme-Selective, Akti2-1/2	30
Akt Inhibitor XIV	31
Akt Inhibitor XIX, 3CAI	14
Akt Inhibitor XV, Isozyme-Selective	31
Akt Inhibitor XVI, AT7867	14
Akt Inhibitor XVIII, SC66	14
InhibitorSelect ™ Akt/PI3-K/mTOR Signaling Pathway Inhibitor Panel	5
ALLM	17
ALLN	17
InSolution™ ALLN	17
Aloisine A	38
Aloisine, RP106	38
Alsterpaullone	38
Alsterpaullone, 2-Cyanoethyl	38
AM251	13
α-Amanitin, Amanita sp.	93
Amastatin, *Streptomyces sp.*	24
Amifostine	11
Amiloride, Hydrochloride	77
ε-Amino-n-caproic Acid	24
3-Aminobenzamide	131
Aminopeptidase N/CD13 Inhibitor	24
Aminopurvalanol A	90
AMN082 Dihydrochloride	13
AMPA Agonist, CMPA	11

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
AMPK Inhibitor, Compound C	31
InSolution™ AMPK Inhibitor, Compound C	31
InSolution™ AMPK Inhibitor, Compound C・2HCl	31
AMPK Signaling Activator XIII, ZLN005	11
Anacardic Acid	95
Anaphase-Promoting Complex Inhibitor Negative Control, AAME	14
Anaphase-Promoting ComplexInhibitor, TAAME	21
Andrographolide	124
Angiogenesis Inhibitor	53
Angiotensin II, Human	106
Aniracetam	13
Anisomycin, Streptomyces griseolus	133
14-3-3 Antagonist I, 2-5	101
14-3-3 Antagonist II,BV02	101
Anthrax Lethal Factor Protease Inhibitor, In-2-LF	24
Anthrax Lethal Factor, Recombinant, *Bacillus anthracis*	41
α1-Antichymotrypsin, Human Plasma	24
Antipain, Dihydrochloride	24
Antipain, Hydrochloride	24
α2-Antiplasmin, Human Plasma	24
Antithrombin III, Human Plasma	24
α1-Antitrypsin, Human Plasma	18
(2R,4R)-APDC	13
APE1 Inhibitor III	12
APETx2, Anthopleura elegantissima, Recombinant, *E. coli.*	13
Aphidicolin	93
Apicidin, Fusarium sp.	95
Apigenin	41
ApoE4 Modulator, PH002	11
Apoptosis Inhibitor	86
Apoptosis Inhibitor II, NS3694	86
APP β-Secretase Inhibitor	121
Aprotinin, Bovine Lung, Crystalline	29
Aprotinin, Bovine Lung, Solution	29
Aprotinin, Bovine, Recombinant, *Nicotiana sp.*, Animal-Free	29
Arcyriaflavin A, Synthetic	90
Aristolochic Acid	116
βARK1 Inhibitor	135
Aromatase Inhibitor I	102
Aromatase Inhibitor II, Letrozole	15
ASIC Channel Modulator II, GMQ	13
(+/-)-Atenolol	12
ATIC Dimerization Inhibitor	11
ATM Kinase Inhibitor	104
InSolution™ ATM Kinase Inhibitor	104
ATM/ATR Kinase Inhibitor	104
Atorvastatin, Calcium Salt	114
ATPA	13
ATR Inhibitor IV	12
ATR Kinase Inhibitor II	15
ATR/CDK Inhibitor, NU6027	88
Aurintricarboxylic Acid	98
Aurora Kinase Inhibitor II	32
Aurora Kinase Inhibitor III	32
Aurora Kinase Inhibitor VI, ZM447439	14
Aurora Kinase Inhibitor XI, HOI-07	14
Aurora Kinase/Cdk Inhibitor	32
Aurothiomalate	124
Autocamtide-2 Related Inhibitory Peptide	32
Autocamtide-2 Related Inhibitory Peptide II	32
Autocamtide-2 Related Inhibitory Peptide II, Cell-permeable	32
Autocamtide-2 Related Inhibitory Peptide, Myristoylated	32
Autophagy Inhibitor IV, Cpd1	15
Autophagy Inhibitor, 3-MA	86
Autotaxin Inhibitor I, S32826	117
Autotaxin Inhibitor II, HA130	117
Autotaxin Inhibitor III, PF-8380	12
Autotaxin Inhibitor IV, HA155	12
AY 9944	135
5-Aza-2'-Deoxycytidine	94
InSolution 5-Aza-2'-Deoxycytidine	12
5-Azacytidine	12
InSolution 1-Azakenpaullone	14
1-Azakenpaullone	38
Aβ42 Fibrillogenesis Inhibitor III	121
B	
b-Catenin/Tcf Inhibitor V, BC21	16
InSolution b-Secretase Inhibitor IV	12
(R)-Baclofen	13
Bafilomycin A1, Streptomyces griseus	77
Baicalein	115
Batimastat	19
Bax Channel Blocker	86
Bax Channel Blocker II, iMAC2	86
Bax-Inhibiting Peptide, Negative Control	86
Bax-Inhibiting Peptide, V5	86
BAY 11-7082	101
InSolution ™ BAY 11-7082	124
BAY 11-7085	101
BCL6 Inhibitor, 79-6	73
Bcl-xL BH44-23, Human, Cell-Permeable	86
Bcr-abl Inhibitor	53
Bcr-abl Inhibitor II	53
Bcr-abl Inhibitor III, GNF-5	53
Bcr-abl Inhibitor IV, Imatinib	14
BCRP Inhbitor	109
BCRP Inhibitor III, YHO-13177	15
5-BDBD	13
BEC, Hydrochloride	128
Benzamidine, Hydrochloride	24

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
Benzyl-2-acetamido-2-deoxy-α-D-galactopyranoside	84
Berberine Chloride	15
Bestatin	24
Bestatin Methyl Ester	24
Bethanechol Chloride	13
Betulinic Acid	135
Bexarotene	11
BHQ	78
(+)-Bicuculline	12
Bikinin	38
BINA	13
Binucleine 2	32
Bisindolylmaleimide I	49
InSolution ™ Bisindolylmaleimide I	49
Bisindolylmaleimide I, Hydrochloride	49
Bisindolylmaleimide II	49
Bisindolylmaleimide IV	49
Bisindolylmaleimide V	49
Blasticidin S, Hydrochloride, *Streptomyces griseochromogenes*	133
(-)-Blebbistatin	77
(±)-Blebbistatin	77
InSolution™ Blebbistatin, Racemic	77
Bmi1-Ring1A E3 Ligase Inhibitor, PRT4165	15
BMP Inhibitor II, DMH1	67
BMX-IN-1	14
Bohemine	90
Bongkrekic Acid, Triammonium Salt	120
Bortezomib	15
BPDQ	53
BPIQ-I	53
bpV(bipy)	68
bpV(HOpic)	68
bpV(phen)	68
BRD2 Inhibitor II, BIC1	73
BRL 44408 Maleate	13
8-Bromo-cGMPS, Rp-Isomer, Sodium Salt	52
Bruton's Tyrosine Kinase Inhibitor III	53
BTS	77
Bufalin	77
Bupropion Hydrochloride	13
2,3-Butanedione 2-Monoxime	77
Butein	53
N-Butyldeoxynojirimycin, Hydrochloride	105
Butyrolactone I	90
BX471	15
BzATP Triethylammonium Salt	13
C	
C5a Receptor Antagonist, W-54011	130
c-Met Kinase Inhibitor III	57
c-Met/RON Dual Kinase Inhibitor	57
c-Myc Inhibitor	101
c-Myc Inhibitor II	101
c-Myc Inhibitor III, Mycro2	101
Ca2+/Calmodulin Kinase II Inhibitor 281-309	32
CA-074 Me	24
CA-074	24
CaCC Blocker IV, Benzbromarone	15
Caffeic Acid	115
Calcineurin Autoinhibitory Peptide	68
Calcineurin Autoinhibitory Peptide, Cell-permeable	68
Calcineurin Inhibitor VIII, CN585	68
Calcium-activated Chloride Channel Inhibitor, CaCCinh-A01	109
Calmidazolium Chloride	77
Calmodulin Binding Domain	32
Calmodulin Kinase IINtide	32
Calmodulin Kinase IINtide, Myristoylated	32
Calpain Inhibitor III	17
Calpain Inhibitor IV	17
Calpain Inhibitor Set	8
Calpain Inhibitor V	17
Calpain Inhibitor VI	17
Calpain Inhibitor XI	17
Calpastatin Peptide	17
Calpastatin Peptide, Negative Control	17
Calpeptin	17
Calphostin C, Cladosporium cladosporioides	49
Calyculin A, Discodermia calyx	68
CaMKII Inhibitor XII	14
CaMKII Inhibitor, CK59	32
CaMKP Inhibitor	68
cAMPS, 8-Bromo-, Rp-Isomer, Sodium Salt	48
cAMPS, Rp-Isomer, TEA Salt	48
Camptothecin, 10-Hydroxy-, *Camptotheca acuminata*	100
Camptothecin, *Camptotheca acuminata*	100
Cancer Hydrolase KIAA1363 Inhibitor, JW480	11
Cantharidic Acid	68
CAPE	124
Captopril	74
Carbonic Anhydrase IX Inhibitor III, Methazolamide	15
Carbonic Anhydrase IX/XII Inhibitor	11
Carbonic Anhydrase IX/XII Inhibitor II, U-104	11
Carbonyl Cyanide m-Chlorophenylhydrazone	120
Carboxyatractyloside, Potassium Salt, Xanthium sibiricum	120
CARM1 Inhibitor	97
Casein Kinase I Inhibitor II, PF-670462	34
Casein Kinase I Inhibitor III,PF-4800567	14
Casein Kinase I Inhibitor V, LH846	14
Casein Kinase I Inhibitor, D4476	33
InSolution™ Casein Kinase I Inhibitor, D4476	33
Casein Kinase II Inhibitor I	33

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
InSolution™ Casein Kinase II Inhibitor I	33
InSolution Casein Kinase II Inhibitor III, TBCA	14
Casein Kinase II Inhibitor III, TBCA	33
Casein Kinase II Inhibitor IV	34
Casein Kinase II Inhibitor V, Quinalizarin	34
Casein Kinase II Inhibitor VI, TMCB	34
Casein Kinase II Inhibitor VIII	14
Casein Kinase II Inhibitor XII, TBBz	14
Caspase Inhibitor I	84
InSolution™ Caspase Inhibitor I	84
Caspase Inhibitor I, Biotin Conjugate	80
Caspase Inhibitor II	80
Caspase Inhibitor II, Cell-Permeable	81
Caspase Inhibitor III	80
Caspase Inhibitor Set I	8
Caspase Inhibitor Set II	8
Caspase Inhibitor Set III	8
Caspase Inhibitor Set IV	8
Caspase Inhibitor VI	81
InSolution™ Caspase Inhibitor VI	81
Caspase Inhibitor VIII	80
Caspase Inhibitor, Negative Control	82
Caspase Modulator I, 1541	82
Caspase-1 Inhibitor I	82
Caspase-1 Inhibitor I, Cell-Permeable	84
Caspase-1 Inhibitor II	84
Caspase-1 Inhibitor IV	84
Caspase-1 Inhibitor VI	80
Caspase-2 Inhibitor I	80
Caspase-3 Inhibitor I	81
Caspase-3 Inhibitor I, Cell-Permeable	82
InSolution™ Caspase-3 Inhibitor I,Cell-Permeable	82
Caspase-3 Inhibitor II	82
InSolution™ Caspase-3 Inhibitor II	82
Caspase-3 Inhibitor III	80
Caspase-3 Inhibitor IV	81
Caspase-3 Inhibitor V	81
Caspase-3 Inhibitor VIII	81
Caspase-3/7 Inhibitor I	81
Caspase-3/7 Inhibitor II	81
Caspase-4 Inhibitor I	80
Caspase-4 Inhibitor I, Cell-Permeable	80
Caspase-5 Inhibitor I	80
Caspase-6 Inhibitor I	80
Caspase-6 Inhibitor II, Cell-Permeable	80
Caspase-8 Inhibitor I, Cell-Permeable	80
Caspase-8 Inhibitor II	80
InSolution™ Caspase-8 Inhibitor II	81
Caspase-9 Inhibitor I	80
InSolution™ Caspase-9 Inhibitor I	81
Caspase-9 Inhibitor II, Cell-Permeable	81
Caspase-9 Inhibitor III	80
Castanospermine, *Castanospermum australe*	105
β-Catenin/Tcf Inhibitor II, PKF118-310	138
β-catenin/Tcf inhibitor III, iCRT3	138
β-Catenin/Tcf Inhibitor VI, ICG-001	16
β-Catenin/Tcf Inhibitor, FH535	138
Cathepsin B Inhibitor II	25
Cathepsin G Inhibitor I	24
Cathepsin Inhibitor I	25
Cathepsin Inhibitor III	25
Cathepsin K Inhibitor I	25
Cathepsin K Inhibitor II	25
Cathepsin K Inhibitor III	25
Cathepsin L Inhibitor I	25
Cathepsin L Inhibitor II	25
Cathepsin L Inhibitor III	25
Cathepsin L Inhibitor IV	25
Cathepsin L Inhibitor, CAA0225	25
Cathepsin S Inhibitor	25
Cathepsin/Subtilisin Inhibitor	25
Caveolin-1 Scaffolding Domain Peptide, Cell-permeable	128
Caveolin-1 Scaffolding Domain Peptide, Cell-permeable, Negative Control	128
CBFb-Runx1 Inhibitor II, Ro5-3335	15
CBFbeta Activator, Kartogenin	12
CBFβ Inhibitor	102
CBP-CREB Interaction Inhibitor	101
CCR2 Antagonist	102
Cdc2-Like Kinase Inhibitor, TG003	91
Cdc2-Like Kinase Inhibitor IV, KH-CB19	11
Cdc7/Cdk9 Inhibitor	90
Cdc25 Inhibitor IV, NSC 95397	14
CDC25 Phosphatase Inhibitor I, BN82002	68
CDC25 Phosphatase Inhibitor II, NSC 663284	68
CDC42 Inhibitor III, ZCL278	12
Cdc42/Rac1 GTPase Inhibitor, ML141	12
CDDO-Me	15
Cdk1 Inhibitor	90
Cdk1 Inhibitor III	90
Cdk1 Inhibitor IV, RO-3306	90
InSolution™ Cdk1 Inhibitor IV, RO-3306	12
Cdk1 Inhibitor, CGP74514A	90
Cdk1/2 Inhibitor II, NU6102	90
Cdk1/2 Inhibitor III	38
Cdk1/5 Inhibitor	38
Cdk2 Inhibitor II	91
Cdk2 Inhibitor III	91
Cdk2 Inhibitor IV, NU6140	91
Cdk2/5 Inhibitor	91

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
Cdk2/9 Inhibitor	91
Cdk4 Inhibitor	91
Cdk4 Inhibitor II, NSC 625987	91
Cdk4 Inhibitor III	91
Cdk4 Inhibitor V	11
Cdk4/6 Inhibitor IV	91
Cdk9 Inhibitor II	92
Cdk Inhibitor, p35	91
Cdk/CKI Inhibitor, (R)-DRF053	91
Cdk/Crk Inhibitor	91
Celastrol, Celastrus scandens	21
Cell Sheet Migration Inhibitor, Locostatin	101
CEP-701	68
Ceramide Kinase Inhibitor II, NVP-231	111
Ceramide Kinase Inhibitor, K1	111
Ceranib-2	12
Cerulenin, *Cephalosporium caerulens*	118
cFMS Receptor Inhibitor II	55
cFMS Receptor Inhibitor III	55
cFMS Receptor Inhibitor IV	55
cFMS Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor	55
InSolution ™ cFMS Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor	55
CFTR Activator, Cact-A1	11
CFTR Inhibitor II, GlyH-101	108
CFTR Inhibitor-172	108
InSolution™ CFTR Inhibitor-172	15
CFTR-F508del Corrector II, Corr-4a	109
CFTR-F508del Corrector, KM11060	108
CGP 7930	13
CGP 35348	13
CGP 37849	13
CGP-37157	120
Chelerythrine Chloride	49
Chk2 Inhibitor	88
InSolution Chk2 Inhibitor II	12
Chk2 Inhibitor II	88
Chk2 Inhibitor, PV1019	88
Chloramphenicol	133
7-Chlorokynurenic Acid Sodium Salt	13
8-(4-Chlorophenylthio)-cGMPS, Rp-Isomer, TEA Salt	52
Chlorpromazine, Hydrochloride	132
Choline Kinase-a Inhibitor, CK37	11
Chymostatin	25
Cilostamide	132
Cinnabarinic acid	13
CIQ	13
2,3 cis-Piperidine dicarboxylic acid	13
CL316243 Hydrate	13
CL-387,785	53
CL-82198	18

製品名	ページ
clasto-Lactacystin β-Lactone	22
Clioquinol	121
(+/-)-Clopidogrel Hydrogensulfate	12
CNQX	13
CNS-1102	13
Coenzyme A, Trilithium Salt	111
Collagenase Inhibitor I	18
Combretastatin A-4	102
Compound 52	91
Compound 56	54
Compound 401	104
Conduritol B Epoxide	105
COX-1 Inhibitor IV, TFAP	112
COX-1 Inhibitor, FR122047	112
COX-2 Inhibitor I	112
COX-2 Inhibitor II	112
COX-2 Inhibitor III	112
COX-2 Inhibitor V, FK3311	112
CP-101,606	13
CP-55940	13
CPCCOEt	13
cPLA2α Inhibitor	116
(R)-CPP	13
(R)-CPPene	13
CR8, (R)-Isomer	90
CR8, (S)-Isomer	90
CRAC Channel Inhibitor IV, EVP4593	14
CRM1 Inhibitor III	11
CRM1 Inhibitor IV, KPT-251	12
Cryptocrome Activator, KL001	11
Cryptotanshinone	66
CTAP	13
CTOP	13
Cucurbitacin I, Cucumis sativus L.	54
Curcumin, Curcuma longa L.	112
Cuspin-1	11
CX546	13
CXCR2 Antagonist, Cpd 19	11
CXCR3 Agonist, PS372424	11
CXCR3 Antagonist	11
CXCR4 Antagonist III	11
CXCR4 Antagonist IV, TF14016	11
CXCR7 Agonist, VUF11207	11
Cyclin-Dependent Protein Kinase Inhibitor Set	8
Cyclo(Arg-Gly-Asp-D-Phe-Val)	101
Cycloheximide	133
InSolution ™ Cycloheximide	133
Cycloheximide, High Purity	133
Cyclooxygenase Inhibitor Set	9
Cyclopamine-KAAD	135

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
InSolution Cyclopamine-KAAD	135
InSolution Cyclopamine, *V. californicum*	16
Cyclopamine, *V. californicum*	135
Cyclopiazonic Acid, *Penicillium cyclopium*	77
Cyclosporin A, *Tolypocladium inflatum*	68
Cyclothiazide	13
Cypermethrin	68
Cystatin C, Human Urine	25
(-)-Cytisine	12
InSolution Cytochalasin D, Zygosporium mansonii	12
Cytoplasmic Dynein Inhibitor, Ciliobrevin D	12
D	
D609, Potassium Salt	116
D-Amino Acid Oxidase Inhibitor	109
D-Amino Acid Oxidase Inhibitor II, CBIO	109
D-Amino Acid Oxidase Inhibitor III, AS057278	15
D-erythro-Sphingosine, Free Base, High Purity	51
D-erythro-Sphingosine, N,N-Dimethyl-	49
D-Val-Phe-Lys Chloromethyl Ketone, Dihydrochloride	29
Daidzein	34
Damnacanthal	54
4-DAMP	13
1,5-Dansyl-Glu-Gly-Arg Chloromethyl Ketone, Dihydrochloride	25
DAPK Inhibitor	73
Daunorubicin, Hydrochloride	100
(S)-3,4-DCPG	13
Deltamethrin	68
Denbufylline	132
5'-Deoxy-5'-methylthioadenosine	54
2-Deoxy-D-galactose (1.24798)	105
N-(n-Butyl)deoxygalactonojirimycin	105
Deoxygalactonojirimycin, Hydrochloride	105
Deoxyhypusine Synthase Inhibitor, GC7	130
1-Deoxymannojirimycin, Hydrochloride	105
1-Deoxynojirimycin, Hydrochloride	105
Dephostatin	69
Dexamethasone	128
DGAT-1 Inhibitor, A 922500	120
Diacylglycerol Kinase Inhibitor I	114
Diacylglycerol Kinase Inhibitor II	114
5,6-Dichloro-1-β-D-ribofuranosylbenzimidazole	34
3,4-Dichloroisocoumarin	117
5,7-Dichlorokynurenic acid sodium salt	13
Diclofenac Sodium	112
Dicoumarol	36
2',5'-Dideoxyadenosine	106
Diethyl Pyrocarbonate	98
7a, 25-dihydroxycholesterol	11
1,1-Dimethyl-4-phenylpiperazinium iodide	13
Dipeptidylpeptidase IV Inhibitor I	26

製品名	ページ
Dipeptidylpeptidase IV Inhibitor III	26
Dipeptidylpeptidase IV Inhibitor IV, K579	26
Diphenyleneiodonium Chloride	129
Divin	11
DL-2-Mercaptomethyl-3-guanidinoethylthiopropanoic Acid	27
DL-Thiorphan	19
DL-threo-PDMP, Hydrochloride	105
DL-α-Difluoromethylornithine, Hydrochloride	128
17-DMAG	110
DMBI	54
DMBO	16
DNA Base Excision Repair Pathway Inhibitor	98
DNA Methyltransferase Inhibitor	94
DNA Methyltransferase Inhibitor II, SGI-1027	84
DNA Polymerase Sliding Clamp Inhibitor, RU7	93
DNA Repair Pathway Inhibitor, NS-123	98
DNA-PK Inhibitor	104
DNA-PK Inhibitor II	104
DNA-PK Inhibitor III	104
DNA-PK Inhibitor V	104
DNQX Disodium Salt	13
Dopamine Receptor Antagonist II, Thioridazine, HCl	11
Doxorubicin, Hydrochloride	100
Doxycycline, Hydrochloride	18
DPDPE	13
DPQ	131
Drosophila Antennapedia Homeo-Domain (43-58)	52
Dual Specificity Protein Phosphatase1/6 Inhibitor, BCI	41
DUB Inhibitor IV, b-AP15	23
DUB Inhibitor V, PR-619	23
DUB Inhibitor VI, P22077	15
Dvl-PDZ Domain Inhibitor II	138
Dvl-PDZ Domain Inhibitor, Peptide Pen-N3	102
Dynamin Inhibitor I, Dynasore	79
Dynamin Inhibitor II, MiTMAB	79
Dynamin Inhibitor III, Phthaladyn-23	79
Dynamin Inhibitor IV, Hydroxy-Dynasore	79
Dynamin Inhibitor V, 34-2	79
Dynorphin A	13
E	
E-64 Protease Inhibitor	26
Ebselen	112
Ecotin, *E. coli*	26
EDTA, Tetrasodium Salt	26
eEF2K Inhibitor, A-484954	14
eEF-2 Kinase Inhibitor, NH125	73
Eg5 Inhibitor III, Dimethylenastron	78
Eg5 Inhibitor IV, VS-83	78
Eg5 Inhibitor VI	78
Eg5 Inhibitor VII	78

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
EGF/FGF/PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor	54
EGFR Inhibitor	54
EGFR Inhibitor II, BIBX 1382	54
EGFR Inhibitor III	54
InhibitorSelect ™ EGFR Signaling Pathway Inhibitor Panel	5
EGFR/ErbB-2 Inhibitor	54
EGFR/ErbB-2/ErbB-4 Inhibitor	54
EGFR/ErbB-2/ErbB-4 Inhibitor II	54
EGLU	13
EHNA, Hydrochloride	132
Eicosapentaenoic Acid	115
eIF2–GTP–tRNAiMetTernaryCompInhib,BTdCPU	15
eIF2–GTP–tRNAiMetTernaryCompInhibNCPdCPU	15
EIF2AK3 Activator, CCT020312	11
eIF4E/eIF4G Interaction Inhibitor, 4EGI-1	69
InSolution eIF4E/eIF4G Interaction Inhibitor, 4EGI-1	15
InSolution eIF-2alpha Inhibitor, Salubrinal	14
eIF-2α Inhibitor II, Sal003	69
eIF-2α Inhibitor, Salubrinal	69
Elastase Inhibitor I	18
Elastase Inhibitor II	18
Elastase Inhibitor III	18
Elastase Inhibitor IV	18
Elastatinal	26
Eliprodil	11
Ellagic Acid, Dihydrate	34
Ellipticine	100
Emetine, Dihydrochloride	133
Emodin	54
Endothall	69
EphA Antagonist	14
(±)-Epibatidine dihydrochloride	13
(-)-Epigallocatechin Gallate	94
Epigenetic Multiple Ligand	95
Epirubicin Hydrochloride	100
Epoxomicin, Synthetic	21
InSolution™ Epoxomicin, Synthetic	21
ErbB2 Inhibitor II	54
ERK Activation Inhibitor Peptide I, Cell-Permeable	41
ERK Activation Inhibitor Peptide II, Cell-Permeable	41
ERK Inhibitor	41
ERK Inhibitor II , negative control	41
ERK Inhibitor II, FR180204	41
ERK Inhibitor III	41
ERK Inhibitor VIII	14
InSolution ERK InhibitorII, FR180204	41
ERK Kinase Kinase 5 Inhibitor	14
ERO1 Inhibitor I, Erodoxin	15
ERO1 Inhibitor II, EN460	15
Erythromycin, Streptomyces erythreus	133
EST	17
ET-18-OCH3	46
N-Ethylmaleimide	78
Etomoxir	120
Etoposide	100
ETYA	113
Ezh2 Inhibitor II, EI1	12
Ezrin Inhibitor, NSC668394	15
F	
FAAH Inhibitor II	118
FAAH Inhibitor III, URB937	15
FABP4 Inhibitor	118
Fas/FasL Antagonist, Kp7-6	86
Fascaplysin, Synthetic	92
Fatostatin	118
FATP2 Inhibitor, CB-2	12
Fatty Acid Synthase Inhibitor, Cpd 10v	12
Fbxo3 Inhibitor, BC-1215	15
Fenobam 1 PC X 5 MG	13
FFN511	13
FGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor	55
FGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor IV, NP603	55
InhibitorSelect ™ FGF Signaling Pathway Inhibitor Panel	5
FGF/PDGF/VEGF RTK Inhibitor	55
FGF/VEGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor, PD173074	55
Fibroblast Growth Factor-2 Inhibitor, NSC37204	74
Flt3 Inhibitor II	55
Flt3 Inhibitor III	55
Flt3 Inhibitor IV	55
Flt-3 Inhibitor	55
Flumazenil	13
Flurbiprofen	112
Fluvastatin, Sodium Salt	114
InSolution Fluvastatin, Sodium Salt	12
FMS/KIT Dual Kinase Inhibitor, PLX647	14
Focal Adhesion Kinase Inhibitor I	54
Focal Adhesion Kinase Inhibitor III	14
FOCUS-Protease Arrest ™ Cocktail	7
Folimycin, *Streptomyces sp.*	78
Formyl Peptide Receptor-Like 1 Antagonist, WRW4	123
Forskolin, Coleus forskohlii in DMSO	11
Fostriecin, Sodium Salt, *Streptomyces pulveraceous*	69
Foxo1 Inhibitor, AS1842856	11
FPRL1 Agonist II, C43	11
FPT Inhibitor I	84
FPT Inhibitor II	84
FPT Inhibitor III	84
FTase Inhibitor I	84
FTI-276	84
FTI-2628	85

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
FtsZ Polymer Stabilizer, PC1	15
Fucosyltransferase Inhibitor, 2F-Peracetyl-Fucose	15
Fumagillin, *Aspergillus fumigatus*	74
Fumitremorgin C, Aspergillus. fumigatus	78
Fumonisin B1, *Fusarium moniliforme*	117
Furin Inhibitor I	18
Furin Inhibitor II	18
FUT-175	26
G	
G 418 Sulfate, Cell Culture Tested	133
G 418 Sulfate, Sterile-Filtered Aqueous Solution, Cell Culture Tested	133
GAG Antagonist, Surfen	40
Galanthamine, Hydrobromide	123
Gallamine Triethiodide	13
GBR 12909 Dihydrochloride	13
Geldanamycin, Streptomyces hygroscopicus	55
Gemcitabine, HCl	11
Genistein	56
Genistin	56
Gentamycin Sulfate	73
GGACK	26
GGTI-286	85
GGTI-298	85
GGTI-2147	85
Ghrelin receptor antagonist, JMV 2959	11
Ginkgolic Acid (15:1)	95
GIRK Activator, ML297	13
Gliotoxin, *Gladiocladium fimbriatum*	124
Glucagon Receptor Antagonist II	105
Glucocorticoid Receptor Modulator, CpdA	129
Glucose Transporter Inhibitor II	15
Glucose Transporter Inhibitor III, STF-31	105
Glucose Transporter Inhibitor IV, WZB117	15
β-Glucuronidase Inhibitor	130
Glutaminase Inhibitor, Compound 968	15
β-Glycerophosphate, Disodium Salt, Pentahydrate	69
Glycogen Phosphorylase Inhibitor	105
InSolution™ GM6001	19
GM 1489	19
GM 6001, Negative Control	19
GM 6001	19
Gö 6976	49
InSolution™ Gö 6976	50
Gö 6983	49
Gö 7874, Hydrochloride	45
Golgicide A	38
GPCR-Helix 8 Signaling Inhibitor, JF5	15
GPR40 Agonist II	11
GPR55 Receptor Antagonist, CID16020046	11

製品名	ページ
GPR81 Agonist, 3Cl-5OH-BA	11
GPR119 Agonist, AS1269574	15
GR113808	13
GR 127935 Hydrochloride	13
Granzyme B Inhibitor I	85
Granzyme B Inhibitor II	85
Granzyme B Inhibitor IV	85
Group III Caspase Inhibitor I	82
GSK3β Inhibitor XIX, IM-12	39
GSK-3 beta Inhibitor XXIV	11
GSK-3 Inhibitor IV, SB-216763	40
GSK-3 Inhibitor IX	38
InSolution™ GSK-3 Inhibitor IX	39
GSK-3 Inhibitor IX, Control, MeBIO	39
GSK-3 Inhibitor X	39
GSK-3 Inhibitor XIII	39
GSK-3 Inhibitor XV	39
GSK-3 Inhibitor XVI	39
InSolution GSK-3 Inhibitor XVI, CHIR99021	14
GSK-3 Inhibitor XXII, Compound A	39
GSK-3 Inhibitor XXIII, 3F8	39
GSK-3b Inhibitor XXV	11
GSK-3b Inhibitor XXVII	73
GSK-3beta Inhibitor XXVI	14
GSK-3β Inhibitor I	38
GSK-3β Inhibitor II	38
GSK-3β Inhibitor VI	38
GSK-3β Inhibitor VII	38
GSK-3β Inhibitor VIII	38
InSolution™ GSK-3β Inhibitor VIII	39
GSK-3β Inhibitor XI	39
GSK-3β Inhibitor XII, TWS119	39
GSK-3β Inhibitor XVIII	39
GSK-3β Peptide Inhibitor, Cell-permeable	38
GTP-14564	56
GTS-21 Dihydrochloride (DMBX-A)	11
2-Guanidinoethylmercaptosuccinic Acid	26
Guanosine 3′,5′-cyclic Monophosphorothioate, β-Phenyl-1,N2-etheno-8-bromo-, RpIsomer, Sodium Salt	52
GW9662	138
GYKI 52466 Hydrochloride	13
GYKI 53655 Hydrochloride	13
H	
H-7, Dihydrochloride	50
H-8, Dihydrochloride	48
H-89, Dihydrochloride	32
InSolution™ H-89, Dihydrochloride	34
H-Arg-Gly-Asp-Ser-OH	100
H-Gly-Arg-Ala-Asp-Ser-Pro-OH	100
H-Gly-Arg-Gly-Asp-Ser-OH	100

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
H-Gly-Arg-Gly-Asp-Ser-Pro-OH	100
H-Gly-Pro-Arg-Pro-OH	74
HA 1004, Dihydrochloride	32
HA 1077, Dihydrochloride	52
Haspin Kinase Inhibitor, CHR-6494	14
HBDDE	50
HDAC Inhibitor XIX, Compound 2	96
HDAC Inhibitor XVII	12
HDAC Inhibitor XXIII, Tubastatin A	12
HDAC Inhibitor XXIV, OSU-HDAC-44	96
HDL Receptor SR-BI Inhibitor, BLT-1	118
Hdm2 E3 Ligase Inhibitor	21
Hdm2 E3 Ligase Inhibitor II, HLI373	11
Heat Shock Factor 1 Inhibitor, KRIBB11	11
Heat Shock Protein Inhibitor I	110
Hec1/Nek2 Mitotic Pathway Inhibitor I, INH1	102
Hec1/Nek2 Mitotic Pathway Inhibitor II, INH6	102
Hedgehog Antagonist VIII	136
HELSS	116
HePTP Inhibitor, ML119	14
Herbimycin A, *Streptomyces sp.*	56
Herg Activator, NS1643	11
Herkinorin	13
Hexamethonium Bromide	13
Hexokinase II Inhibitor II, 3-BP	73
Hexokinase II VDAC Binding Domain Peptide, Cell-Permeable	120
β-Hexosaminidase Inhibitor	105
Hh Signaling Antagonist VII, JK184	135
Hh Signaling Antagonist XI, MRT-14	16
Hh Signaling Antagonist XII, HPI-1	135
Hh Signaling Antagonist XII, MRT-83	16
Hh Signaling Antagonist XIII, HPI-3	135
Hh Signaling Antagonist XIV, SANT-2	135
Hh Signaling Pathway Modulators	141
Hh/Gli Antagonist, GANT58	136
Hh/Gli Antagonist, GANT61	136
HIF Inhibitor V	15
HIF Inhibitor VI	11
HIF Inhibitor VII	15
HIF Prolyl Hydroxylase Inhibitor	74
HIF-1 Inhibitor	74
HIF-1α Translation Inhibitor, KC7F2	74
HIF-1α/2α Inhibitor IV, FM19G11	74
HIF-2α Translation Inhibitor	74
HIF-Hydroxylase Inhibitor, DMOG	74
HIF-PHD Inhibitor II, JNJ-42041935	11
Hirudin, Hirudo medicinalis, Recombinant, *Saccharomyces cerevisiae*	26
Hispidin	50
Histone Acetyltransferase Inhibitor II	95
Histone Acetyltransferase Inhibitor IV, CPTH2	95
Histone Acetyltransferase Inhibitor VIII, NU9056	12
Histone Acetyltransferase p300 Inhibitor II, L002	12
Histone Acetyltransferase p300 Inhibitor, C646	95
Histone Deacetylase Inhibitor II	95
Histone Deacetylase Inhibitor III	95
Histone Deacetylase Inhibitor IV	95
Histone Deacetylase Inhibitor VI, HNHA	95
Histone Deacetylase Inhibitor VII, 106	95
Histone Deacetylase Inhibitor VIII	96
Histone Lysine Demethylase I	12
Histone Lysine Demethylase Inhibitor IX, PBIT	12
Histone Lysine Demethylase Inhibitor VIII, GSK-J4	12
Histone Lysine Methyltransferase Inhibitor	97
Histone Methyltransferase EZH2 Inhibitor, DZNep	11
HistoneAcetylTransferase Inhib VII CTK7A	95
HMTase Inhibitor II, Chaetocin	97
HMTase Inhibitor IV, UNC0638	11
HMTase Inhibitor IX, MM-102	12
HMTase Inhibitor V, UNC0224	11
HMTase Inhibitor VI, BRD4770	97
HNF4 Antagonist, BI6015	15
HNMPA-(AM)3	56
Homoquinolinic acid	13
11β-HSD1 Inhibitor, 10j	118
Hsp25 Kinase Inhibitor	41
HSP70 Activator II, YM-08	15
Hsp70 Activator, YM-1	11
HSP90 Inhibitor, CCT018159	110
Hydroxyfasudil	64
4-Hydroxynonenal	78
4-Hydroxyphenylretinamide	74
Hygromycin B, *Streptomyces sp.*	133
Hypericin	34
Hypoestoxide, *Hypoestes rosea*	124
Hypothemycin	73
I	
Ibotenic Acid	13
(±)-Ibuprofen	112
IC261	34
ICMT Inhibitor	130
ICMT Inhibitor II, FTPAT	15
Idazoxan Hydrochloride	13
IDH1 Inhib, R132 Somatic Mutant-Specific	15
Ifenprodil Hemitartrate	13
InhibitorSelect ™ IGF Signaling Pathway Inhibitor Panel	5
IGF-1R Inhibitor II	56
IGF-1R Inhibitor, PPP	56
IKK Inhibitor II, Wedelolactone	124
IKK Inhibitor III, BMS-345541	124

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
IKK Inhibitor VII	125
IKK Inhibitor X	125
IKK Inhibitor XII	125
IKK Inhibitor XIII, 17-AJB	125
IKK-2 Inhibitor IV	124
InSolution™ IKK-2 Inhibitor IV	125
IKK-2 Inhibitor V	124
IKK-2 Inhibitor VI	125
IKK-2 Inhibitor VIII	125
IKK-2 Inhibitor XI	125
IKK-2 Inhibitor, SC-514	124
InSolution™ IKK-2 Inhibitor, SC-514	125
IKK-3 Inhibitor IX	125
IL-1R Antagonist	102
IL-2Rα Antagonist	102
ILK Inhibitor, Cpd 22	14
IM-412	67
Importazole	16
INCB 3284 dimesylate	15
Indirubin Derivative E804	92
Indirubin-3'-monoxime	40
Indirubin-3'-monoxime-5-sulphonic acid	40
Indirubin-3'-monoxime, 5-Iodo-	40
Indomethacin	113
Indomethacin, 2′ -Trifluoromethyl	12
INDY	16
Integrin αvβ3 Antagonist, P11	101
Interferon-α-IFNα-R Interaction Inhibitor	87
InSolution™ Interleukin-1 Receptor-Associated-Kinase-1/4 I	14
5-Iodo-A-85380 dihydrochloride hydrate	13
α-Iodoacetamide	26
Iodoacetic Acid, Sodium Salt	26
Ionomycin, Calcium Salt, Streptomyces conglobatus in Solution	12
IP3K Inhibitor	118
iPSC Induction Enhancer II, OAC1	16
iPSC Induction Enhancer, Thiazovivin	16
IQ-1	138
IRAK-1/4 Inhibitor	73
IRE1 Inhibitor I, STF-083010	130
IRE1 Inhibitor II	15
IRE1 Inhibitor III, 4u8C	15
IRTK Activator III, DDN	11
Ischemin	16
3-Isobutyl-1-methylxanthine	132
Isogranulatimide	40
Isohelenin, Inula sp.	125
1,5-Isoquinolinediol	131
ITSA1	96
IκB Kinase Inactive Control Peptide, Cell-Permeable	124
IκB Kinase Inhibitor Peptide, Cell-Permeable	124

製品名	ページ
J	
JAK2 Inhibitor II	56
JAK2 Inhibitor IV	40
JAK2 Inhibitor V, Z3	40
JAK3 Inhibitor I	56
JAK3 Inhibitor II	56
JAK3 Inhibitor IV	56
JAK3 Inhibitor V	56
JAK3 Inhibitor VI	56
JAK3 Inhibitor VII, AD412	57
JAK3 Inhibitor VIII, NSC114792	14
JAK3 Inhibitor, Negative Control	40
JAK3/GSK-3β/PKCα Inhibitor	57
InSolution ™ JAK Inhibitor I	56
JAK Inhibitor I	40
JAK Inhibitor I	56
JAK Inhibitor III, SD-1029	60
InhibitorSelect ™ JAK/STAT Signaling Pathway Inhibitor Panel	5
Jervine	136
JMJD2 Inhibitor, 5-carboxy-8HQ	97
JMJD Histone Demethylase Inhibitor III	12
JMJD Histone Demethylase Inhibitor IV, M	12
JNJ 16259685	13
JNK Inhibitor I, (L)-Form, Cell-Permeable	35
JNK Inhibitor I, (L)-Form, Cell-Permeable, Negative Control	35
InSolution™ JNK Inhibitor II	35
JNK inhibitor II	35
JNK Inhibitor II, Negative Control	35
JNK Inhibitor III, Cell-Permeable	35
JNK Inhibitor III, Cell-Permeable, Negative Control	35
JNK Inhibitor IX	35
JNK Inhibitor V	35
JNK Inhibitor VI, TI-JIP 153-163	35
JNK Inhibitor VII, TAT-TI-JIP 153-163, Cell-Permeable	35
JNK Inhibitor VIII	35
JNK Inhibitor X, BI-78D3	35
JNK Inhibitor XI, BI-87G3	35
JNK Inhibitor XIII	36
JNK Inhibitor XIII, SR-3306	36
JNK Inhibitor XV, IQ-1S	14
JNK Inhibitor XVI, JNK-IN-8	36
JNK-3 Inhibitor XII, SR-3576	36
JQ1 Enantiomers Set	15
JWH 015	13
K	
InSolution™ K-252a, *Nocardiopsis sp.*	33
K-252a, *Nocardiopsis sp.*	33
K-252c	50
Kaempferol	113
Kanamycin Sulfate, *Streptomyces kanamyceticus*	134

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
Kenpaullone	40
Keratinocyte Differentiation Inducer	33
Ketanserin Tartrate	13
Ketoconazole	115
(Z-LL)2 Ketone	26
Kifunensine, Kitasatosporia kifunense	105
Kininogen, High Molecular Weight, Single Chain, Human Plasma	26
Kir1.1 Inhibitor, VU591	13
Kir2.1 Inhibitor, ML133	11
KLF5 Inhibitor, CID 5951923	15
KMO Inhibitor I, Ro 61-8048	12
KMO Inhibitor II, JM6	12
KN-62	33
KN-92	33
KN-93, Water-Soluble	33
InSolution™ KN-93	33
KN-93	33
InSolution™ KT5720	48
KT5720	48
KT5823	52
Kynurenic Acid Sodium Salt	13
L	
L3MBTL3 MBT Domain Blocker, UNC1215	15
L-701,324	13
L-741,626	13
L-744,832	85
L-745,870 Trihydrochloride	13
L- Buthionine Sulfoximine	15
L-(+)-2-Amino-4-phosphonobutyric Acid	11
L-CCG-I	13
L-N5-(1-Iminoethyl)ornithine, Dihydrochloride	129
L-NIL, Dihydrochloride	129
L-type Calcium Channel Blocker VIII	12
Lactacystin, Synthetic	21
Lactimidomycin	15
Lavendustin A	57
Lck Inhibitor	57
Lck Inhibitor II	57
Lck Inhibitor III	57
LDN-211904	15
InSolution™ Leptomycin B, *Streptomyces sp.*	96
Leukadherin-1	11
Leupeptin, Hemisulfate	23
Leupeptin, Hemisulfate, Synthetic	23
LFM-A13	57
Licofelone, Potassium Salt, Monohydrate	12
LIM Kinase Inhibitor I, LIMKi 3	14
m-Iodobenzylguanidine, Hemisulfate	120

製品名	ページ
Longdaysin	16
Loperamide Hydrochloride	13
Lovastatin	114
Lovastatin, Sodium Salt	114
InSolution™ Lovastatin, Sodium Salt	12
LP-44 Hydrochloride	13
LRRK2 Inhibitor II, CZC-25146	14
LRRK2 Inhibitor III, HG-10-102-01	14
LRRK2-IN-1	120
LSD1 Inhibitor	96
LSD1 Inhibitor II, S2101	96
LSD1 Inhibitor III, CBB1007	12
LSD1 Inhibitor IV, RN-1,HCl	12
LSF Inhibitor, FQI1	15
Luciferase Inhibitor I	133
Luciferase Inhibitor II	133
Luteolin	130
LY 83583	128
LY 294002, 4′-NH2	46
InSolution™ LY 294002	46
LY 294002	46
LY 303511	46
LY 344864 Hydrochloride	13
LY 354740	13
LY 367385 Hydrochloride 1 PC X 5 MG	13
LY-404,039	13
LYP Inhibitor II, LTV-1	14
M	
α2-Macroglobulin, Human Plasma	26
MAGL Inhibitor III, JZL184	118
MALT1 Inhibitor I, MI-2	15
MALT1 Inhibitor II	15
Manumycin A, *Streptomyces parvulus*	117
MAP Kinase Cascade Inhibitor Set	9
MAP Kinase Inhibitor Set I	9
MAP Kinase Inhibitor Set II	9
InhibitorSelect ™ MAP Kinase Signaling Pathway Inhibitor Panel	5
Marimastat	27
MARK/Par-1 Activity Inhibitor, 39621	109
Mastoparan	78
MAT2A Inhibitor II, FIDAS-5	15
Mcl-1 Inhibitor, MIM1	11
(S)-MCPG 1 PC X 10 MG	13
MDL-12,330A, Hydrochloride	106
MDM2 Antagonist II, NSC 66811	104
MDM2 Antagonist IV, Nutlin-3a	88
MDM2 Antagonist, Nutlin-3, Racemic	104
MDM2 Inhibitor	104

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
MDM2 Inhibitor VII, MEL23	15
MDM2/MDMX Dual Inhibitor, RO-5963	12
MDMX Antagonist, SJ-172550	80
MDMX Inhibitor, NSC207895	11
Mecamylamine Hydrochloride	13
MEK1/2 Inhibitor	44
MEK1/2 Inhibitor II	44
MEK1/2 Inhibitor III	44
InSolution MEK1/2 Inhibitor III, PD03259	14
MEK1/2 Inhibitor IV	41
MEK Inhibitor I	44
MEK Inhibitor II	44
MEK Inhibitor Set	9
Melatonin	129
Melittin	50
Meloxicam	113
Memantine Hydrochloride	13
Membrane Traffic Inhibitor, A5	102
Menin-MLL Interaction Inhibitor, MI-2-2	15
Mer RTK Inhibitor, UNC569	57
Merbarone	100
Meriolin 2	92
Meriolin 3	92
Met Kinase Inhibitor	57
Met Kinase Inhibitor VI, SGX523	57
Met/Flt-3/VEGFR2 Tyrosine Kinase Inhibitor	57
MetAP2 Inhibitor, A832234	103
2-Methoxyestradiol	74
8-Methoxymethyl-3-isobutyl-1-methylxanthine	132
Methyl Arachidonyl Fluorophosphonate	116
α,β-methylene ATP	14
Methylene Blue	128
(2S,4R)-4-methylglutamate	13
Methyllycaconitine Citrate	13
Methysergide Maleate	13
Mevastatin	114
Mevastatin, Sodium Salt	114
MG-115	22
InSolution™ MG-132	22
MG-132	22
MIF Antagonist III, 4-IPP	99
MIF Antagonist IV, RDR 03785	16
MIF Antagonist, ISO-1	99
Mifepristone	74
Milrinone	132
Minocycline, Hydrochloride	20
Mirk/Dyrk1B Inhibitor, Compo	14
MitoBloCK-6	15

製品名	ページ
Mitochondrial ATF Translocator, SBI-0087702	12
Mitochondrial CTP Inhibitor	87
Mitochondrial Division Inhibitor, mdivi-1	120
Mitochondrial Fusion Promoter, M1	12
Mitochondrial Pyruvate Carrier Inhibitor, UK5099	15
mitoNEET InhibitorNL-1,Thiazolidinedione	11
MK2a Inhibitor	41
MK-2 Inhibitor III	41
MK-886	115
ML243	16
ML-7, Hydrochloride	45
ML-9, Hydrochloride	45
MLKL Inhibitor, Necrosulfonamide	11
MMP Inhibitor I	19
MMP Inhibitor II	19
MMP Inhibitor III	20
MMP Inhibitor Set I	9
MMP Inhibitor V	20
MMP-2 Inhibitor I	19
MMP-2 Inhibitor II	20
MMP-2 Inhibitor III	20
MMP-2 Inhibitor IV	14
MMP-2/MMP-3 Inhibitor III, PD166793	20
MMP-2/MMP-9 Inhibitor I	19
MMP-2/MMP-9 Inhibitor II	19
MMP-2/MMP-9 Inhibitor III	19
MMP-2/MMP-9 Inhibitor IV	20
MMP-2/MMP-9 Inhibitor V	20
MMP-3 Inhibitor I	19
MMP-3 Inhibitor II	19
MMP-8 Inhibitor I	19
MMP-9 Inhibitor I	20
MMP-9 Inhibitor II	15
MMP-9/MMP-13 Inhibitor I	19
MMP-12 Inhibitor, MMP408	20
MMP-13 Inhibitor	20
MMPIP 1 PC X 1 MG	13
MNK1 Inhibitor	41
MNK1/2 Inhibitor II, ETP-45835	11
Monastrol	78
MPEP Hydrochloride 1 PC X 10 MG	13
MPS1 Inhibitor, NMS-P715	88
MPTP Hydrochloride	13
MRN-ATM Pathway Inhibitor, Mirin	104
MRP1 Inhibitor II, Reversan	109
MRS 2211	13
MT1-MMP Inhibitor, NSC405020	15
MTEP Hydrochloride	13

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
mTOR Activator, MHY1485	15
mTOR Inhibitor III, PP242	44
mTOR Inhibitor IV, Ku-63794	44
mTOR Inhibitor XI, ETP-46464	12
mTOR Inhibitor XI, Torin1	14
mTOR Inhibitor XII, Torin2	14
mTOR Kinase Inhibitor II, WYE-354	44
InhibitorSelect ™ mTOR Signaling Inhibitors	11
Muscimol	13
Myeloperoxidase Inhibitor-II	14
Myosin Light Chain Kinase Inhibitor Peptide 18	45
MyoVin-1	16
Myricetin	46
N	
N(G),N(G)'-Dimethyl-L-arginine, DiHCl	129
Na+/H+ Exchanger Isoform-1 Inhibitor	109
NAADP Receptor Modulator	109
NAAG	13
NAE Inhibitor, MLN4924	15
Naltrindole, Hydrochloride	31
α-Naphthyl Acid Phosphate, Monosodium Salt	69
NBD-Binding Peptide II, Cell Permeable, CTP-NBD	14
NBI-31772	102
NDGA, Larrea divaricata	115
Nebivolol Hydrochloride	13
Necrosis Inhibitor, IM-54	87
Necrostatin-1, Inactive Control	87
Necrostatin-1	87
Nef Hck Activation Inhibitor, B9	15
Nefazodone Hydrochloride	13
NEMO-Binding Domain Binding Peptide, Cell-Permeable	125
NEMO-Binding Domain Binding Peptide, Cell-Permeable, Negative Control	125
Neomycin Sulfate	116
Neomycin Sulfate, γ-Irradiated, Tissue Culture Grade	116
Neuroprotectant, OBA-09	14
Neurotrope J147	13
Neurotrophin Antagonist, Y1036	57
NF023	109
NF449	109
NF-B Activation Inhibitor	125
NF-B Activation Inhibitor VII, CID-2858522	125
NF-kappaB Inhibitor Methysticin	15
InSolution™ NF-κB Activation Inhibitor	126
NF-κB Activation Inhibitor II, JSH-23	126
NF-κB Activation Inhibitor III	126
NF-κB Activation Inhibitor IV	126
NF-κB Activation Inhibitor VI, BOT-64	126

製品名	ページ
InhibitorSelect ™ NF-κB Signaling Pathway Inhibitor Panel	5
NF-κB SN50, Cell-Permeable Inhibitor Peptide	126
NF-κB SN50M, Cell-Permeable Inactive Control Peptide	126
NFAT Activation Inhibitor III	69
NFAT Inhibitor, MCV1	15
NG-Hydroxy-L-arginine, Monoacetate Salt	128
NG-Monomethyl-L-arginine, Monoacetate Salt	129
NG-Nitro-L-arginine Methyl Ester, Hydrochloride	129
NG,NG-Dimethyl-L-arginine, Dihydrochloride	129
Nicotinamide Phosphoribosyltransferase Inhibitor, FK866	132
Nifuroxazide	66
Nimesulide Analog, Compound 76	113
NIPP-1, His・Tag®, Bovine Thymus, Recombinant, *E. coli*	70
5-Nitro-2-(3-phenylpropylamino)benzoic Acid	113
7-Nitroindazole	129
3-Nitropropionic acid	15
NMDA Antagonist XI, N1-dansyl-spermine	13
NMDAR2C/2D Inhibitor, DQP-1105	13
nNOS - PSD-95 InteractionInhibitor,ZL006	11
nNOS Inhibitor I	129
Nodinitib-1	14
nor-Binaltorphimine Dihydrochloride	13
Notch Transcription Factor Inhibitor, SAHM1	123
Novel Inducer of Death-1, NID-1	12
Novobiocin, Sodium Salt	93
NOX1 Inhibitor, ML171	130
NOX Inhibitor III, VAS2870	130
NOX Inhibitor VII, Thr101	14
Nrf2 Activator II, AI-1	11
Nrf2 Activator III, TAT-14 Peptide	11
NS1738	13
NS3763	13
NS8593	13
NS 2028	128
NS-398	112
NU1025	131
Nur77 LBD Antagonist, TMPA	11
InSolution™ Nutlin-3, Racemic	104
NVP-AAM077 Tetrasodium Hydra	13
Nα-Tosyl-Lys Chloromethyl Ketone, Hydrochloride	29
Nα-Tosyl-Phe Chloromethyl Ketone	117
Nω-Hydroxy-nor-L-arginine, Diacetate Salt	128
O	
O-1602	13
O-GlcNAcase Inhibitor, TMG	15
o-Phenanthroline	27
ODQ	128
Okadaic Acid, Ammonium Salt	69

製品名	ページ
Okadaic Acid, Potassium Salt	69
InSolution™ Okadaic Acid, Prorocentrum concavum	70
Okadaic Acid, Prorocentrum concavum	70
Okadaic Acid, Sodium Salt	69
Oligomycin	78
InSolution™ Olomoucine	92
Olomoucine	92
Olomoucine II	92
InSolution™ OM99-2	121
Omeprazole	78
Omi/HtrA2 Protease Inhibitor, Ucf-101	87
Oncrasin-1 (Oncogenic Ras Tumor-Inhibiting Compound 1)	87
Oridonin, R. rubescens	126
Ornithine Decarboxylase Inhibitor, POB	128
Ouabain, Octahydrate	79
OXE-R-Gβγ Coupling Modulator	12
Oxidized ATP (oATP)	13
(5Z)-7-Oxozeaenol, *Curvularia sp.*	126
Oxymetazoline Hydrochloride	13
P	
P2X Antagonist III	11
P2Y Antagonist II	11
p21-Activated Kinase Inhibitor II, PF-3758309	14
p21-Activated Kinase Inhibitor III, IPA-3	45
p21-Activated Kinase Inhibitor, PAK18	45
p21-Activated Kinase Inhibitor, Negative Control	45
p38 MAP Kinase Inhibitor	42
InSolution™ p38 MAP Kinase Inhibitor III	42
p38 MAP Kinase Inhibitor III	42
p38 MAP Kinase Inhibitor IV	42
p38 MAP Kinase Inhibitor IX	42
p38 MAP Kinase Inhibitor V	42
p38 MAP Kinase Inhibitor VI, JX401	42
p38 MAP Kinase Inhibitor VII, SD-169	42
p38 MAP Kinase Inhibitor VIII	42
p38 MAP Kinase Inhibitor X, BIRB 796	42
p38 MAP Kinase Inhibitor XI	14
p38 MAP Kinase Inhibitor XIX, Skepinone-L	14
InhibitorSelect ™ p53 Pathway Ragulators Panel	6
p53-Snail binding inhibitor, GN25	98
p97 ATPase Activity Inhibitor, DBeQ	22
p-APMSF, Hydrochloride	24
p-Nitroblue Tetrazolium Chloride	129
PACOCF3	116
PAD Inhibitor, Cl-amidine	130
Palmitoylethanolamide	13
Pancuronium Dibromide	13
Paroxetine Hydrochloride	13

製品名	ページ
PARP Inhibitor IX, EB-47	131
PARP Inhibitor Set	9
InSolution™ PARP Inhibitor VIII, PJ34	15
PARP Inhibitor XI, DR2313	131
PARP Inhibitor XII	131
PARP Inhibitor XIV	131
Parthenolide, *Tanacetum parthenium*	126
InSolution™ PD 98059	57
PD 98059	42
(±)-PD 128907 Hydrochloride	13
PD 150606	17
InSolution™ PD 153035	53
PD 153035	53
InSolution™ PD 158780	58
PD 158780	58
PD 166285	70
PD 168077 Maleate	13
PD 168393	57
PD 169316	42
PD 174265	58
PDE4D Inhibitor, GEBR-7b	11
PDE10A Inhibitor, Cpd15	15
PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor II	58
PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor III	58
PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor IV	58
PDGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor V	58
PDGFR Tyrosine Kinase Inhibitor VI, SU6668	58
PDGFR Tyrosine Kinase Inhibitor VII	58
PDGFR/VEGFR2 Tyrosine Kinase Inhibitor, 5-Br SU6668	58
PDGFRβ/RAF Kinase Inhibitor	58
PDK1 Inhibitor II	58
PDK1/Akt/Flt Dual Pathway Inhibitor	31
1-PDX, Human, Recombinant, *E. coli*	23
Pentoxifylline	101
Pepstatin A Methyl Ester	121
Pepstatin A, Penetratin	27
Pepstatin A, Synthetic	27
PERK Inhibitor I, GSK2606414	14
PFKFB3 Inhibitor, 3PO	15
15-PGDH Inhibitor	12
PHA-543,613	14
PHCCC	14
Phenylarsine Oxide	70
Phenylmethylsulfonyl Fluoride	27
Philanthotoxin-7,4	14
Phloretin	50
Phorbol-12,13-dibutyrate	79
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set II	8

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set III	8
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set IV	8
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set V	8
Phosphatase Inhibitor Cocktail Set V, 50X, Lyophilized	8
Phosphodiesterase Inhibitor Set I	9
Phosphoramidon, Disodium Salt	29
PI 3-K inhibitor IX, PIK-90	47
PI 3-K/mTOR Inhibitor III, PKI-179	14
PI 3-K/PDK-1 Inhibitor, NVP-BAG956	47
PI 3-Kβ Inhibitor VI, TGX-221	47
PI 3,4-K inhibitor, PIK-93	14
PI 3-Kδ Inhibitor X, IC87114	47
PI 3-K Inhibitor XI, HWT	47
PI 3-K Inhibitor XVIII	14
PI 3-Kα Inhibitor IV	46
PI 3-Kα Inhibitor VIII	47
PI 3-Kγ Inhibitor	46
PI 3-Kγ Inhibitor II	46
PI 3-Kγ Inhibitor VII	47
PI 3-Kγ/CKII Inhibitor	47
InSolution™ PI-103	46
PI-103	46
Piceatannol	45
PICK1 PDZ Domain Inhibitor FSC231	123
Pifithrin-α	87
Pifithrin-α, Cyclic-	87
Pifithrin-α, p-Nitro, Cyclic	98
Pifithrin-μ	98
PIKfyve Inhibitor	46
PIM1 Inhibitor III	92
PIM1 Kinase Inhibitor II	92
PIM1 Kinase Inhibitor IV	92
PIM1/2 Kinase Inhibitor V	92
PIM1/2 Kinase Inhibitor VI	92
PIM-Kinase Inhibitor IX, SGI-1776	14
PIM-Kinase Inhibitor X, CX-6258	14
PIP3 Antagonist II, DM-PIT-1	16
PIP3 Antagonist, PITenin-7	16
PIPER	99
Piperlongumine	15
Pirenzepine Dihydrochloride	14
PJ34	131
PK11195	14
PKC Activator VIII, CGK062	16
PKC θ/δ Inhibitor	51
PKCβ Inhibitor	51
PKCβII/EGFR Inhibitor	51
PKD Inhibitor, CID755673	33

製品名	ページ
PKM2 Activator II, DASA	11
PKM2 Activator III	11
PknG Inhibitor	52
InSolution PKR Inhibitor	14
PKR Inhibitor	65
PKR Inhibitor III, 7DG	15
PKR Inhibitor, Negative Control	65
Plasminogen Activator Inhibitor-1, Human, Recombinant	21
Plasminogen Activator Inhibitor-1, Mutant, Human, Recombinant	21
Plasminogen Activator Inhibitor-1, Mutant, Mouse, Recombinant	21
PLD Inhibitor, FIPI	11
Pluripotin	141
PNU 282987	11
PNU-120596	14
Polo-like Kinase Inhibitor I	88
Polo-like Kinase Inhibitor II, BTO-1	88
Polo-like Kinase Inhibitor III	58
Polo-like Kinase Inhibitor IV, SBE13	88
Polo-like Kinase Inhibitor V, Poloxin	14
Polymyxin B Sulfate	50
PON1 Activator, ZNPA	11
Porcn Inhibitor II, C59	16
Porcn Inhibitor III, IWP-L6	16
InSolution™ PP1 Analog	59
PP1 Analog	59
InSolution PP1 Analog II, 1NM-PP1	14
PP1 Analog II, 1NM-PP1	33
PP1 Analog III, 3-MB-PP1	73
PP1 Analog IV, 3-IB-PP1	14
PP1 Analog V, 2,3-DMB-PP1	59
InSolution™ PP2	59
PP2	58
PP3	58
PPACK II, Trifluoroacetate Salt	27
PPACK, Dihydrochloride	27
PPACK, Dihydrochloride, Biotinylated	27
PPAR Agonist IX, GQ-16	12
PPARb/d Antagonist, GSK3787	11
PPARb/d Antagonist, PT-S58	15
PPARbeta/delta Inverse Agonist	15
PPARg Modulator, SR1664	11
PPARγ Antagonist III, G3335	118
(RS)-PPG 1 PC X 5 MG	13
PPIase-Parvulin Inhibitor	98
PPM1D Phosphatase Inhibitor	70
Pramipexole Dihydrochloride	14
Pravastatin, Sodium Salt	114
Prazosin Hydrochloride	14

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
PrCP Inhibitor	15
Pre-mRNA Splicing Inhibitor, Isoginkgetin	101
Prionogenesis inhibitor, DAPH-12	123
Pristimerin	119
PRL-3 Inhibitor	71
PRMT Inhibitor VI	12
Pro-survival Compound, DDD00033325	16
Prodigiosin Serratia marcescens	14
proINDY	16
Prolyl Endopeptidase Inhibitor II	29
Protease Arrest ™ Reagent	7
Protease Inhibitor Cocktail Set I	7
Protease Inhibitor Cocktail Set I, Animal-Free	7
Protease Inhibitor Cocktail Set II	7
Protease Inhibitor Cocktail Set III	7
Protease Inhibitor Cocktail Set III, Animal-Free	7
Protease Inhibitor Cocktail Set IV	7
Protease Inhibitor Cocktail Set V, Animal-Free	7
Protease Inhibitor Cocktail Set V, EDTA-Free	7
Protease Inhibitor Cocktail Set VI	7
Protease Inhibitor Cocktail Set VII	8
Protease Inhibitor Cocktail Set VIII	7
Protease Inhibitor Set	7
InSolution™ Proteasome Inhibitor I	22
Proteasome Inhibitor I	22
Proteasome Inhibitor II	22
Proteasome Inhibitor III	22
Proteasome Inhibitor IV	22
Proteasome Inhibitor Set I	9
Proteasome Inhibitor Set II	9
Proteasome Inhibitor VIII, β-Lactam 3	22
Proteasome Inhibitor X, PI-083	22
Proteasome Inhibitor XX, GL5	22
Proteasome Inhibitor XXI, Z-LLLL-SF	15
Protein Arginine N-Methyltransferase Inhibitor, AMI-1	85
Protein Disulfide Isomerase Inhibitor III PACMA31	15
Protein Kinase A Inhibitor 5-24	48
Protein Kinase A Inhibitor 6-22 Amide	48
Protein Kinase A Inhibitor 14-22 Amide, Cell-Permeable, Myristoylated	48
Protein Kinase C Inhibitor 20-28, Cell-Permeable, Myristoylated	50
Protein Kinase C Inhibitor Peptide 19-31	49
Protein Kinase C Inhibitor Peptide 19-36	50
Protein Kinase C Inhibitor Set	9
Protein Kinase C Inhibitor, EGF-R Fragment 651-658, Myristoylated	50
Protein Kinase Cε Translocation Inhibitor Peptide	50
Protein Kinase Cε Translocation Inhibitor Peptide, Negative Control	50
Protein Kinase Cζ Pseudosubstrate Inhibitor	50
Protein Kinase Cζ Pseudosubstrate Inhibitor, Myristoylated	50
Protein Kinase Cη Pseudosubstrate Inhibitor, Myristoylated	50
Protein Kinase Cθ Pseudosubstrate Inhibitor, Myristoylated	51
Protein Kinase G Inhibitor	52
Protein Kinase G Iα Inhibitor, Cell-Permeable	52
Protein Kinase Inhibitor Set	9
Protein Methyltransferase Inhibitor II, BIX-01338	12
Protein Methyltransferase Inhibitor, AMI-5	85
Protein Phosphatase 2A Inhibitor I2PP2A, Human, Recombinant, *E. coli*	70
Protein Phosphatase Inhibitor 2, Human, Recombinant, *E. coli*	70
Protein Phosphatase Inhibitor Set II	8
Protein Synthesis Initiation Inhibitor, NSC 119889	85
Protein Tyrosine Phosphatase Inhibitor I	71
Protein Tyrosine Phosphatase Inhibitor III	71
Protein Tyrosine Phosphatase Inhibitor IV	71
Proteinase K Inhibitor	29
ProteinLysMethyltransferaseInhibitor, UNC	101
PSD95 Inhibitor, Tat-N-dimer	15
Pterostilbene, Pterocarpus marsupium	113
PTK/PI 3-K/mTOR Inhibitor, PP121	47
InSolution™ PTP1B Inhibitor	71
PTP1B Inhibitor	71
PTP CD45 Inhibitor	71
PTP Inhibitor V, PHPS1	71
PTP Inhibitor XVIII	71
PTP Inhibitor XXXI, II-B08	14
PTP LYP Inhibitor	71
Purmorphamine	136
Puromycin, Dihydrochloride	134
Puromycin, Dihydrochloride, Cell Culture-Tested	134
Purvalanol A	93
1-Pyrrolidinecarbodithioic Acid, Ammonium Salt	130
Pyruvate Kinase Activator	11
Q	
InSolution™ Q-VD-OPh, Non-O-methylated	84
QNZ46	11
Quercetagetin	73
Quercetin, Dihydrate	47
Quinacrine, Dihydrochloride	123
(-)-Quinpirole Hydrochloride	13
Quisqualic acid	15
R	
Rab7 GTPase Inhibitor, CID 1067700	12
InSolution™ Rac1 Inhibitor	79

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
Rac1 Inhibitor	79
Rac1 Inhibitor II	79
InSolution Rac1 Inhibitor II, Z62954982	79
Rac Inhibitor III, EHop-016	12
(S)-(-)-Raclopride	13
Rad6 Inhibitor	15
RAD51 Inhibitor II, RI-1	12
RAD51 Inhibitor, B02	88
Radicicol, *Diheterospora chlamydosporia*	113
InSolution™ Raf1 Kinase Inhibitor I	64
Raf1 Kinase Inhibitor I	64
Raf Kinase Inhibitor IV	64
Raf Kinase Inhibitor V	64
Raf Kinase Inhibitor VI	64
RAGE Antagonist Peptide, RAP	15
RAGE Antagonist, FPS-ZM1	11
InSolution™ Rapamycin	31
Rapamycin	31
InSolution™ Rapamycin in EtOH	31
Ras-Net (Elk-3) Pathway Inhibitor, XRP44X	102
Ras/Rac Transformation Blocker, SCH 51344	103
InSolution™ Ratjadone A, Synthetic	96
Rb/Raf-1 Disruptor 251	64
Reboxetine Mesylate	14
Resveratrol	113
RET Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor	59
REV-ERB Agonist II, SR9009	11
Reversine	141
RGS Proteins Inhibitor II, CCG-50014	11
RHC-80267	114
Rho Inhibitor II	12
Rho Inhibitor, Rhosin	12
InSolution™ Rho Kinase Inhibitor	64
Rho Kinase Inhibitor	64
Rho Kinase Inhibitor III, Rockout	64
Rho Kinase Inhibitor IV	64
Rho Kinase Inhibitor V	64
Rho Kinase Inhibitor VII	64
Rho-Kinase Inhibitor II	64
Rho/SRF Pathway Inhibitor, CCG-1423	64
Ribonuclease Inhibitor, Human, Recombinant, *E. coli*	98
Rifampicin	94
RIP1 Inhibitor II, 7-Cl-O-Nec-1	11
InSolution RNA Polymerase III Inhibitor	12
RNA Polymerase III Inhibitor	94
RNA-Editing Ligase 1 Inhibitor, NSC 45208	134
Ro106-9920	115
Ro 25-6981 Maleate Salt	14
Ro-20-1724	132
Ro-31-7549	51
InSolution™ Ro-31-8220	51
Ro-31-8220	40
Ro-31-8425	51
Ro-32-0432	51
Rolipram	132
RORα/γ Agonist, SR1078	11
RORγ Inverse Agonist, SR2211	101
ROS Inhibitor, YCG 063	130
InSolution™ Roscovitine	93
Roscovitine	93
Roscovitine, (S)-Isomer	93
Rosiglitazone	11
Rotenone	120
Rotigotine Hydrochloride	14
Rottlerin	51
RS 102895 hydrochloride	15
RS 127445 Hydrochloride	14
RSK2 Inhibitor, RMM-46	14
RSK Inhibitor II	59
RSK Inhibitor, SL0101	59
Ru360	120
RuBi-Nicotine	14
RubR1 Activator, GF-15	11
RXRα Inhibitor, K-80003	119
RyR-Calstabin Interaction Stabilizer, S107	12
S	
S1P1 Receptor Agonist III	11
S6K1 Inhibitor II, DG2	59
S6K1 Inhibitor, PF-4708671	59
S18986	14
S 24795	14
S-Methyl-L-thiocitrulline, Dihydrochloride	129
S-Methylisothiourea, Sulfate	129
Safingol	51
Salbutamol Hemisulfate	14
Salmeterol Xinafoate	14
Salvinorin A	14
Sangivamycin	51
SANT-1	136
SB 202190, Hydrochloride	43
InSolution™ SB 202190	43
SB 202190	42
SB 202474	42
SB 203580, Hydrochloride	43
SB 203580, Iodo-	43
SB 203580, Sulfone	43

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
InSolution™ SB 203580	43
SB 203580	42
SB 206553 Hydrochloride	14
SB 218078	88
SB 220025	43
SB 225002	121
SB 239063	43
SB 242084 Hydrochloride	14
SB 328437	109
SB 399885 Hydrochloride	14
SB 699551 Dihydrochloride	14
SB-269970 Hydrochloride	14
SB-277011-A Dihydrochloride	14
SBHA	96
SC-560	113
SC-68376	43
SCH 23390 Hydrochloride	14
Scriptaid	96
SecinH3	131
γ-Secretase Inhibitor I	121
β-Secretase Inhibitor II	121
γ-Secretase Inhibitor II	121
β-Secretase Inhibitor III	122
β-Secretase Inhibitor IV	122
γ-Secretase Inhibitor IV	121
InSolution™ γ-Secretase Inhibitor IX	122
γ-Secretase Inhibitor IX	121
γ-Secretase Inhibitor VI	121
InSolution™ γ-Secretase Inhibitor X	121
γ-Secretase Inhibitor XI	121
γ-Secretase Inhibitor XII	122
γ-Secretase Inhibitor XVI	122
γ-Secretase Inhibitor XX	122
γ-Secretase Inhibitor XXI	122
γ-Secretase Inhibitor XXI, Compound E	122
γ-Secretase Inhibitor XXII , Ab42-Selective, CS-1	122
γ-Secretase Inhibitor XXIV, BMS299897	122
γ Secretase Inhibitor, FT-9	12
γ40-Secretase Inhibitor I	121
Serine Protease Inhibitor Cocktail Set I	8
Serine/Threonine Kinase Inhibitor Set	31
sFRP Inhibitor II	138
Shikonin	75
SHIP2 Inhibitor	65
SHIP2 Inhibitor, 3AC	65
SHP1/2 PTPase Inhibitor, NSC-87877	71
Sialyltransferase Inhibitor, 3Fax-Peracetyl Neu5Ac	15
Simvastatin	114
InSolution Simvastatin, Sodium Salt	12
Simvastatin, Sodium Salt	114
InSolution™ Sinefungin	94
Siomycin A, *Streptomyces sioyaensis*	134
SIRT1 Inhibitor III	96
SIRT1 Inhibitor IV, (S)-35	97
Sirt1 Inhibitor VII, Inauhzin	12
SIRT1/2 Inhibitor IV, Cambinol	96
SIRT1/2 Inhibitor VII	97
SIRT1/2 Inhibitor VIII, Salermide	97
SIRT2 Inhibitor II, AK-1	97
SIRT2 Inhibitor, AGK2	97
SIRT2 Inhibitor, Inactive Control, AGK7	97
InSolution™ Sirtinol	96
Sirtinol	96
(R)-(+)-SKF38393 Hydrochloride	13
SKF-525A, Hydrochloride	130
SKF-86002	113
SKP2 E3 Ligase Inhibitor I, C1	15
SKP2 E3 Ligase Inhibitor II, SMIP004	15
Smad3 Inhibitor, SIS3	67
N-SMase Inhibitor, GW4869	117
SMC Proliferation Inhibitor-2w	103
Smoothened Agonist, SAG	138
SNC80	14
SOD1 Inhibitor, LCS-1	130
Sodium Orthovanadate	71
Sodium Salicylate	113
Sodium Stibogluconate	72
Soluble Epoxide Hydrolase Inhibitor, NCND	102
Spautin-1	80
Spectinomycin, Dihydrochloride, Pentahydrate, *Streptomyces sp.*	134
Spermidine, Trihydrochloride	130
Spermine, Tetrahydrochloride	117
Sphingosine Kinase 1 Inhibitor II, PF-54	12
Sphingosine Kinase 1 Inhibitor, SKI-178	12
Sphingosine Kinase Inhibitor	12
Sphingosine Kinase Inhibitor	119
sPLA2-IIA Inhibitor I	116
$sPLA_2$-IIA Inhibitor II, KH064	12
Splitomicin	97
SQ 22536	106
SR95531 (Gabazine)	14
SR 144528	14
Src Family Protein Tyrosine Kinase Inhibitor Set	9
Src Inhibitor PP1	59
Src Kinase Inhibitor I	59
Src Kinase Inhibitor II	59

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
SREBP Processing Inhibitor, Betulin	119
SRPK Inhibitor, SRPIN340	14
SRT1720	97
ST638	59
STAT3 Inhibitor III, WP1066	66
STAT3 Inhibitor IX, Cpd188	66
STAT3 Inhibitor IX, HJB	66
STAT3 Inhibitor Peptide	66
STAT3 Inhibitor Peptide, Cell-Permeable	66
STAT3 Inhibitor Peptide, Cell-permeable, Inactive Control	66
STAT3 Inhibitor V, Stattic	66
InSolution™ STAT3 Inhibitor VI, S3I-201	66
STAT3 Inhibitor VI, S3I-201	66
STAT3 Inhibitor VII	66
STAT3 Inhibitor VIII, 5,15-DPP	66
STAT3 Inhibitor XI, STX-0119	14
STAT3 Inhibitor XII, SPI	14
STAT3 Inhibitor XIV, LLL12	15
STAT3 Inhibitor XVI	66
STAT3 Inhibitor XVIII, BP-1-102	14
STAT5 Inhibitor	66
STAT5 Inhibitor II, IQDMA	66
Staurosporine, N-Benzoyl	45
InSolution™ Staurosporine, *Streptomyces sp.*	48
Staurosporine, *Streptomyces sp.*	45
Ste11 MAPKKK Activation Inhibitor	59
Stearoyl-CoA Desaturase Inhibitor, MF-43	15
Stem-Cell Factor/c-Kit Inhibitor, ISCK03	59
STO-609	31
Streptomycin Sulfate, *Streptomyces sp.*	134
SU1498	60
InSolution™ SU5402	59
SU5402	59
SU5614	59
InSolution™ SU6656	60
SU6656	59
SU9516	93
SU11652	60
Sulindac Sulfide	113
(S)-Sulpiride	13
Suramin, Sodium Salt	79
Survivin Antagonist, S12	87
Survivin Inhibitor III	15
Survivin Inhibitor, YM155	15
Swainsonine, *Swainsona canescens*	105
Syk Inhibitor	60
Syk Inhibitor II	60
Syk Inhibitor III	60
Syk Inhibitor IV, BAY 61-3606	60
Syk Inhibitor V	60
Syk Inhibitor VI, R406	15
T	
T0070907	119
Tamoxifen Citrate	51
Tamoxifen, 4-Hydroxy-, (Z)-	51
Tamsulosin Hydrochloride	14
Tankyrase1/2 Inhibitor	16
Tankyrase1/2 Inhibitor III	15
Tankyrase1/2 Inhibitor IV, JW55	15
Tankyrase1/2 Inhibitor, XAV939	138
Tankyrase 1/2 Inhibitor VI, G007-LK	15
TAPI-0	18
InSolution™ TAPI-1	18
TAPI-1	18
TAPI-2	18
TAS-301	103
Tau Aggregation Inhibitor, ATPZ, Cpd16	123
Tautomycin, *Streptomyces spiroverticillatus*	72
TCEP, Hydrochloride, Reagent	15
TCN-201	14
Telomerase Inhibitor III, Sodium Salt	99
Telomerase Inhibitor IX	99
Temozolomide	11
Tenovin-1	97
(-)-Terreic Acid, Synthetic	60
Tetracycline, Hydrochloride	134
InSolution™ Tetrahydrouridine	15
TGF-β RI Inhibitor III	67
TGF-β RI Inhibitor IV	67
TGF-β RI Inhibitor V	67
TGF-β RI Kinase Inhibitor	67
TGF-β RI Kinase Inhibitor II	67
TGF-β RI Kinase Inhibitor IX	67
InSolution™ TGF-β RI Kinase Inhibitor VI, SB431542	67
TGF-β RI Kinase Inhibitor VI、SB431542	67
TGF-β RI Kinase Inhibitor VII	67
TGF-β RI Kinase Inhibitor VIII	67
InhibitorSelect ™ TGF-βR and BMPR Signaling Pathway Inhibitor Panel	6
(±)-Thalidomide	75
Thapsigargin	79
InSolution™ Thapsigargin	12
Thiostrepton	134
Thymidylate Kinase Inhibitor, YMU1	15
Tiagabine Hydrochloride	14
Tie2 Kinase Inhibitor	60

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
Tie2/Trk Dual Inhibitor	15
TIMP-1, Human Neutrophil Granulocyte	21
TIMP-2, Human Rheumatoid Synovial Fibroblast	21
TIRAP Inhibitor Peptide, Cell-Permeable	126
TIRAP Inhibitor Peptide, Control, Cell-Permeable	126
TLR1/TLR2 Antagonist, CU-CPT22	12
TLR3/dsRNA Complex Inhibitor	12
TLR4 Inhibitor, TAK-242	12
InhibitorSelect ™ TLR Signaling Pathway Panel	15
TMEM16A Activator, Eact	11
TMEM16A Inhibitor, T16Ainh-A01	12
TMPyP4	99
TNAP Inhibitor	72
TNF-α Antagonist III, R-7050	86
TNF-α Inhibitor	86
TNP-470	16
InSolution™ TNP-ATP	13
Tobramycin, Free Base	134
TOFA	111
Tomatidine, HCl	138
Topoisomerase II Inhibitor, BNS-22	12
Topoisomerase IIα Inhibitor, TSC24	100
Tpl2 Kinase Inhibitor	43
Tpl2 Kinase Inhibitor II	43
TPRC3 Channel Inhibitor III, Pyr10	12
Tranilast	75
Transglutaminase 2 Inhib Neg Control, Zc	123
Trequinsin, Hydrochloride	132
InSolution™ Trichostatin A, *Streptomyces sp.*	97
Trichostatin A, *Streptomyces sp.*	97
Trio N-Terminal RhoGEF Domain Inhibitor, ITX3	79
Trk Inhibitor III, GNF-5837	15
TrkA Inhibitor	60
TrpA1 Antagonist, HC-030031	14
TRPM4 Inhibitor, 9-Phenanthrol	12
TRPML Agonist, ML-SA1	11
TRPV4 Antagonist I, RN-1734	11
TRPV4 Antagonist II, HC-067047	11
TRPV4 Antagonist III, GSK205	11
Trypsin Inhibitor, Corn	29
Trypsin Inhibitor, Soybean	29
Trypsin Inhibitor, Soybean, High Activity	29
(+)-Tubocurarine Chloride	11
Tubulin Polymerization Inhibitor II	98
Tumor Necrosis Factor-α Antagonist	86
Tunicamycin, *Streptomyces lysosuperficus*	105
TX-1123	48
TX-1918	73
Tyrosine Kinase Inhibitor Set II	9
U	
U0124	43
InSolution™ U0126	43
U0126	43
U18666A	138
U-73122	117
U-73343	117
Ubiquitin Aldehyde	23
Ubiquitin E1 Inhibitor, PYR-41	23
Ubiquitin Isopeptidase Inhibitor I, G5	23
UBP310	14
UCH-L1 Inhibitor	23
UCH-L1 Inhibitor II	23
UCH-L3 Inhibitor	23
UCN-01	40
Urea Transporter B Inhibitor	15
Ursolic Acid	66
USP14-Proteasome Inhibitor, IU1	23
V	
V-ATPase Inhibitor, KM91104	79
Vacuolin-1	103
Valinomycin, *Streptomyces fulvissimus*	120
Valproic Acid, Sodium Salt	97
VEGF Inhibitor, CBO-P11	62
VEGF Inhibitor, Flt2-11	62
VEGF Inhibitor, Je-11	62
VEGF Inhibitor, V1	62
VEGF Receptor 2 Kinase Inhibitor I	61
VEGF Receptor 2 Kinase Inhibitor II	62
VEGF Receptor 2 Kinase Inhibitor III	62
VEGF Receptor 2 Kinase Inhibitor IV	62
VEGF Receptor 3 Kinase Inhibitor, MAZ51	62
VEGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor II	61
VEGF Receptor Tyrosine Kinase Inhibitor IV	61
InhibitorSelect ™ VEGF Signaling Pathway Inhibitor Panel	5
VEGFR2 Kinase Inhibitor VI, Ki8751	61
VEGFR2 Kinase Inhibitor VII, SKLB1002	62
VEGFR2/Flt3/c-Kit Inhibitor	62
VEGFR Tyrosine Kinase Inhibitor V	62
VEGFR Tyrosine Kinase Inhibitor VI, AAL-993	62
VEGFR/Tie-2/PDGFR Tyrosine Kinase Inhibitor	62
Vicriviroc Malate	15
Vigabatrin	14
VU0155041 Sodium Salt	14
W	
W-5, Hydrochloride	45
W-7, Hydrochloride	45

製品名索引（アルファベット順）

製品名	ページ
W-12, Hydrochloride	45
W-13, Hydrochloride	45
WAY-100635 Maleate	14
Wee1 Inhibitor	88
Wee1 Inhibitor II	88
Wee1/Chk1 Inhibitor	88
WHI-P180, Hydrochloride	93
(+)-WIN 55,212-2 mesylate	12
Withaferin A, Withania somnifera	75
Wnt Agonist II, SKL2001	11
InSolution Wnt Antagonist I, IWR-1-endo	11
Wnt Antagonist I, IWR-1-endo	139
Wnt Antagonist II, IWP-2	139
Wnt Antagonist III, Box5	139
Wnt Antagonist III, CCT036477	139
Wnt Pathway Inhibitor XII, 21H7	139
InhibitorSelect ™ Wnt Signaling Pathway Inhibitor Panel	6
Wnt Synergist, QS11	138
Wnt/β-catenin Inhibitor, Cardamonin	139
Wortmannin	47
InSolution™ Wortmannin	47
WP1130	16
WRN Helicase Inhibitor, NSC 19630	123
X	
Xanomeline Oxalate	14
Y	
InSolution Y-27632 in DMSO	65
InSolution™ Y-27632	65
Y-27632	65
YM298198 Hydrochloride	14
Yohimbine Hydrochloride	14
Z	
Z-Guggulsterone	118
Zaprinast	132
(5Z)-Zeaenol, *Curvularia sp.*	126
Zebularine	94
Zinc (II) Protoporphyrin IX	130
ZK-756326	11
ZM 336372	43

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
03-34-0001-25MG	74
03-34-0002-25MG	100
03-34-0027-25MG	100
03-34-0035-5MG	100
03-34-0051-5MG	17
03-34-0052-5MG	100
05-23-0101-1MG	106
05-23-4904-1MG	49
100050-5MG	128
100066-25MG	124
100068-500UG	110
100069-500UG	110
100073-10MG	12
100081-5MG	101
100082-10MG	101
100109-10MG	116
100128-5MG	53
101500-50MG	23
104550-25MG	116
104551-10MG	118
108975-5MG	23
108976-10MG	23
110123-5MG	100
110165CBC-25MG	15
110175-1MG	23
112252-5MG	15
114666-5MG	93
114802-250UG	21
114810-5MG	18
116765-10MG	11
116805-500UG	48
116814-5UMOL	48
116816-5UMOL	48
116819-5UMOL	48
116825-5UMOL	48
116850-5MG	106
116860-10MG	15
116890-5MG	73
118415-60UG	131
118490-10MG	11
118500-2MG	104
118501-5MG	104
118502-2MG	104
118510-10MG	15
119113-5MG	133
119114-5MG	133
119150-10MG	11
119152-5MG	11
121765-2MG	53
121767-1MG	53
123850-25MG	133
123855-25MG	15
123871-25MG	11
124005-1MG	30
124008-1MG	30
124009-1MG	30
124011-1MG	30
124012-1MG	30
124013-2MG	30
124014-2MG	30
124015-1MG	30
124017-1MG	30
124018-1MG	30
124019-5MG	30
124020-5MG	30
124028-5MG	30
124029-2MG	30
124030-2MG	30
124031-1EA	5
124032-10MG	31
124033-10MG	14
124034-2MG	31
124036-25MG	14
124037-25MG	14
124038-2MG	31
126850-2.5MG	23
126870-1MG	38
126871-1MG	38
128125-5MG	38
128135-5MG	38
128136-1MG	11
129741-1MG	93
129874-50MG	11
129875-1MG	24
129876-100MG	77
129935-1MG	93
138000-50MG	109
138001-50MG	109
1381-500GM	24
155306-5MG	11
164603-50MG	15
164606-10MG	24
164640-5MG	90
165300-1MG	11
165350-100MG	131
169756-1MG	24
171260-1MG	31
171261-1MG	31
171264-2MG	31
171588-5MG	121
171601-500UG	121
172050-10MG	95
172060-50MG	124
172103-50MG	14
172104-50MG	21
175580-10MG	53
176880-10MG	133
176900-100UG	41
176901-1MG	24
178196-100UG	24
178220-5MG	24
178221-100UG	24
178223-10MG	24
178251-1MG	18
178273-1MG	93
178276-1MG	95
178278-5MG	41
178281-5MG	24
178477-10MG	11
178488-10MG	86
178494-10MG	86
178506-10MG	14
181305-1MG	90
182015-1MG	101
182200-5MG	135
182300-50MG	116
182540-1MG	102
182541-25MG	15
182690-10MG	11
182705-10MG	74
182707-10MG	11
189291-100MG	114
189299-10MG	88
189400-100MG	98
189401-50MG	124
189404-1MG	32
189405-1MG	32
189406-5MG	32
189410-5MG	14
189412-10MG	14
189480-500UG	32
189482-500UG	32
189484-1MG	32
189485-1MG	32
189490-50MG	86
189510-5MG	117
189511-10MG	117
189512-10MG	12
189513-10MG	12
189825-25MG	94
189826-10MG	12
190080-5MG	135
191500-1MG	38
191501-500UG	14
196000-10UG	77
196322-10MG	115
196440-5MG	19
196805-5MG	86
196806-10MG	86
196810-5MG	86
196811-5MG	86
196870-10MG	101
196871-10MG	124
196872-10MG	101
197217-1MG	86
197221-5MG	53
197223-5MG	53
197224-10MG	53
197226-10MG	109
197227-10MG	15
197345-50MG	73
197900-5MG	128
199001-5GM	24
200100-100MG	84
200275-25MG	15
200484-10MG	24
200485-5MG	24
200498-5MG	135
200499-50MG	11
200980-25MG	38
201125-5MG	32
203290-250UG	49
203291-250UG	49
203292-1MG	49
203293-1ML	49
203297-1MG	49
203303-250UG	49
203350-25MG	133
203389-5MG	77
203390-5MG	77
203391-1MG	77
203392-1MG	77
203600-1MG	90
203600-5MG	90
203630-25MG	15
203646-5MG	67
203661-1MG	53
203671-500UG	120
203694-5MG	68
203695-10MG	68

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
203696-1MG	53
203697-1MG	53
203701-5MG	68
203830-10MG	73
203881-5MG	90
203882-5MG	90
203895-5MG	77
203900-10MG	77
203984-500MG	77
203987-5MG	53
203988-200UG	90
203994-5MG	105
203996-10MG	105
205530-1MG	24
205531-1MG	24
205546-500MG	115
207000-250UG	68
207001-1MG	68
207003-10MG	68
208293-10MG	109
208294-25MG	12
208665-10MG	77
208711-500UG	32
208719-5MG	17
208721-25MG	17
208722-25MG	17
208724-1MG	17
208725-50UG	49
208726-1MG	17
208733-1SET	8
208734-1MG	32
208743-1MG	17
208745-1MG	17
208750-5MG	17
208775-100MG	68
208851-10UG	68
208902-500UG	17
208904-500UG	17
208920-1MG	32
208921-1MG	32
208922-5MG	32
208923-5MG	14
208925-50MG	100
210150-10MG	68
211200-25MG	124
211875-1GM	74
215900-5MG	11
215901-5MG	11
215902-50MG	15
215911-250MG	120
215921-500MG	132
216201-2MG	120
217505-250MG	101
217531-10MG	97
217691-5MG	68
217692-5MG	68
217694-10MG	14
217695-5MG	90
217696-5MG	90
217697-1MG	90
217699-5MG	90
217707-5MG	90
217708-25MG	12
217713-1MG	90
217714-1MG	38
217720-5MG	38
217721-2MG	12
218696-1MG	33
218697-10MG	33
218705-1MG	33
218708-5MG	33
218710-5MG	33
218713-5MG	33
218714-5MG	34
218716-5MG	34
218717-50MG	34
218718-10MG	34
218719-5MG	14
218728-1MG	80
218729-1MG	80
218735-1MG	80
218742-1MG	80
218744-250UG	80
218745-250UG	80
218746-250UG	80
218750-1MG	80
218753-1MG	80
218755-1MG	80
218757-250UG	80
218759-250UG	80
218761-250UG	80
218766-1MG	80
218767-1MG	80
218772-1SET	8
218773-1MG	80
218775-1MG	105
218776-1MG	81
218806-1SET	8
218825-1SET	8
218826-1MG	81
218830-1MG	81
218832-1MG	81
218840-250UG	81
218841-250UG	81
218850-10MG	14
218860-10MG	14
218861-5MG	14
219002-1MG	81
219007-250UG	81
219011-1MG	81
219013-10MG	81
219330-10MG	138
219331-10MG	138
219332-10MG	138
219334-10MG	16
219372-1MG	24
219377-5MG	25
219379-1MG	25
219381-1MG	25
219385-1MG	25
219393-1MG	25
219415-1MG	25
219419-1MG	25
219420-1MG	25
219421-1MG	25
219426-5MG	25
219427-5MG	25
219428-1SET	8
219433-1MG	25
219445-1MG	91
219448-5MG	91
219457-1MG	91
219465-10MG	21
219469-10MG	101
219476-1MG	91
219477-5MG	91
219478-5MG	91
219479-5MG	91
219482-1MG	128
219483-1MG	128
219489-1MG	111
219491-1MG	91
219492-5MG	91
219493-10MG	111
219494-5MG	91
219499-5MG	68
219502-1MG	25
219503-5MG	11
219505-10MG	102
219506-10MG	15
219511-10MG	11
219556-10MG	12
219557-5MG	118
219670-5MG	108
219671-5MG	108
219673-10MG	109
219674-5MG	15
219676-5MG	108
220005-5MG	120
220285-5MG	49
220485-500UG	88
220486-1MG	88
220488-10MG	88
220491-5MG	12
220551-25GM	133
227016-5MG	102
229103-5MG	11
230790-5MG	25
231085-10MG	132
233100-1MG	53
233105-5MG	18
233165-1GM	121
233624-25MG	11
233630-10MG	66
234101-100MG	111
234140-5MG	18
234200-10MG	102
234415-1MG	130
234490-1MG	53
234491-500UG	53
234501-5MG	104
234503-1MG	91
234505-500UG	54
234599-100MG	105
235420-1MG	81
235421-1MG	81
235423-1MG	82
235427-1MG	82
235429-1SET	8
236005-5MG	112
236007-10MG	112
236011-5MG	112
236012-5MG	112
236013-25MG	112
236015-5MG	112
236020-5MG	120
238100-10MG	11
238590-1MG	54
238803-1MG	91
238804-5MG	91

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
238806-5MG	91
238811-5MG	92
239763-1GM	133
239764-100MG	133
239765-1ML	133
239783-1SET	9
239802-100MG	112
239803-1MG	135
239804-100UG	135
239804-500UG	135
239805-5MG	77
239806-5MG	16
239807-50UG	135
239819-2MG	11
239822-10MG	11
239823-5MG	11
239824-10MG	11
239835-100MG	68
239900-10MG	68
240896-50UG	25
250401-10MG	12
251400-5MG	116
251406-50MG	15
251600-25MG	34
251650-1MG	54
251700-5MG	25
251800-5MG	100
252790-2MG	11
252801-5MG	120
253300-10MG	68
253500-5MG	132
259544-5MG	105
259545-10MG	130
259580-1GM	105
260575-5MG	105
260585-50MG	54
260684-10MG	105
260920-10MG	94
260921-10MG	84
260930-25MG	93
260960-10MG	104
260961-5MG	104
260962-1MG	104
260964-1MG	104
262015-25MG	98
262017-10MG	12
263200-1MG	69
264155-250UG	82
264156-250UG	82
264157-10MG	82
265005-100MG	128
266785-5MG	114
266788-5MG	114
286888-100MG	78
287815-10MG	117
287840-1GM	112
287891-50MG	34
287895-1MG	52
287897-500MG	36
288104-1MG	106
288500-25MG	128
298711-25GM	98
300260-10MG	129
300270-1MG	131
310500-5MG	49
311203-25MG	129
311204-25MG	129
317200-10MG	54
317201-10MG	16
317496-10MG	41
317641-5MG	26
317642-5MG	26
322337-2MG	102
322338-10MG	138
323115-25MG	98
324380-10MG	100
324385-1GM	18
324387-2GM	11
324410-10MG	79
324411-500MG	79
324412-10MG	79
324413-10MG	79
324414-10MG	79
324473-1MG	131
324483-5MG	112
324515-5MG	73
324516-10MG	14
324517-10MG	69
324519-5MG	15
324622-1MG	78
324623-5MG	78
324629-5MG	78
324630-10MG	132
324631-5MG	78
324673-1MG	54
324674-1MG	54
324683-500MG	34
324688-10MG	100
324691-5MG	26
324692-1MG	18
324693-250MG	133
324694-50MG	54
324732-5MG	54
324744-5MG	18
324745-5MG	18
324759-1MG	18
324760-20MG	69
324788-10MG	73
324800-100UG	21
324801-50UG	21
324813-25MG	102
324832-5MG	54
324833-5MG	54
324839-1EA	5
324840-1MG	54
324841-2MG	54
324842-5MG	54
324875-25MG	115
324877-5MG	54
324879-5MG	11
324880-10MG	94
324888-10MG	95
324889-10MG	15
324890-1MG	26
324892-10MG	15
324895-5MG	69
324896-5MG	69
324897-5MG	14
324905-5MG	100
328000-1MG	41
328005-1MG	41
328006-5MG	41
328007-1MG	41
328008-1MG	41
328009-5MG	41
328010-500UG	41
328011-10MG	14
328500-25MG	15
328501-25MG	15
329815-5GM	133
330005-1MG	17
330200-100UG	26
34103-500GM	26
34115-5GM	78
341205-25MG	100
341207-5MG	46
341216-10MG	15
341249-5MG	118
341251-1MG	92
341253-5MG	15
341291-25MG	86
341310-5MG	118
341326-5MG	12
341329-25MG	118
341598-10MG	74
341607-5MG	55
341608-5MG	55
341609-5MG	55
341610-5MG	55
341612-1EA	5
342000-1MG	82
343020-5MG	55
343021-1MG	55
343022-5MG	55
343023-5MG	55
344036-1MG	55
344037-1MG	55
344038-1MG	55
344039-5MG	55
344041-1MG	55
344045-1ML	7
344079-100MG	112
344085-10UG	78
344095-25MG	114
344096-10MG	12
344149-10MG	11
344150-1MG	84
344152-1MG	84
344154-1MG	84
344220-5MG	123
344280-10UG	69
344282-5MG	11
344301-10MG	138
344355-10MG	11
344510-1MG	84
344550-250UG	84
344559-500UG	85
344580-5MG	15
344827-10MG	15
344845-500UG	74
344847-250UG	78
344850-1MG	117
344930-1MG	18
344931-1MG	18
344960-5MG	26
345670-20MG	123
345805-100UG	55
345810-250MG	133
345812-10ML	133
345814-1GM	73

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
345834-20MG	56
345836-5MG	56
345862-10MG	38
345878-250UG	85
345883-250UG	85
345885-250UG	85
345887-5MG	95
345888-10MG	11
346003-5MG	105
346110-25MG	129
347423-10MG	130
347436-5MG	26
349254-5MG	112
351801-10MG	105
352010-10MG	15
35675-50GM	69
361515-1MG	105
361540-5MG	38
361541-5MG	38
361546-1MG	38
361547-5MG	38
361548-5MG	38
361549-5MG	38
361550-1MG	38
361550-10MG	38
361551-1MG	39
361552-500UG	39
361553-1MG	39
361554-1MG	39
361555-1MG	39
361556-1MG	39
361557-5MG	39
361558-1MG	39
361559-5MG	39
361562-5MG	39
361563-5MG	39
361564-10MG	39
361565-10MG	39
361566-10MG	40
361567-5MG	11
361568-10MG	11
361569-5MG	14
361570-10MG	73
361571-5MG	14
362330-100MG	40
364200-1MG	19
364205-1MG	19
364206-1MG	19
364210-1MG	19
365250-500UG	49
365251-500UG	49
365252-500UG	45
365253-1ML	50
368050-1MG	85
368055-1MG	85
368056-1MG	85
368620-1MG	82
369334-5MG	26
370653-10MG	52
370654-1MG	52
370655-1MG	52
370674-5UMOL	52
370677-1UMOL	52
370679-1UMOL	52
370681-25MG	12
370690-10MG	118
370700-5MG	138
371715-1MG	124
371721-10MG	11
371724-10MG	15
371758-100MG	11
371806-5MG	56
371825-10MG	15
371955-1MG	50
371957-1MG	40
371958-1MG	48
371962-1MG	34
371963-1MG	32
371964-1MG	32
371970-1MG	52
372040-10MG	14
372770-1MG	50
373210-25MG	118
373225-5MG	21
373226-5MG	11
373227-10MG	15
373260-5MG	110
373270-10MG	102
373271-10MG	102
373273-10MG	135
373275-10MG	135
373276-10MG	135
373277-10MG	16
373278-5MG	16
373385-5MG	135
373386-1EA	141
373400-5MG	136
373401-5MG	136
373402-5MG	136
373501-10MG	11
374085-5MG	116
375240-25MG	15
375645-10MG	14
375670-100UG	56
376816-1MG	120
376817-100MG	73
376820-10MG	105
377853-2000U	26
377980-2MG	50
382110-10MG	95
382111-10MG	95
382113-10MG	95
382115-10MG	95
382148-5MG	95
382149-1MG	95
382170-10MG	95
382172-10MG	95
382173-5MG	95
382175-1MG	96
382177-50MG	96
382181-10MG	96
382187-5MG	12
382190-5MG	97
382191-500UG	97
382192-2MG	11
382193-5MG	11
382194-10MG	97
382425-10MG	132
385570-10MG	11
385581-10MG	118
385585-10MG	15
385880-1MG	41
385920-5MG	110
390238-25MG	100
390602-2MG	64
390900-5MG	74
393204-1MG	78
397100-5MG	56
399250-5MG	128
399275-1MG	128
400010-1MG	82
400011-1MG	84
400012-5MG	84
400015-1MG	84
400035-10MG	15
400036-25MG	15
400051-100KU	133
400076-1MG	34
400083-10MG	74
400084-10MG	74
400086-5MG	11
400087-10MG	74
400088-25MG	74
400089-10MG	74
400090-5MG	34
400091-50MG	74
400093-10MG	11
400600-20MG	129
401003-1GM	112
401006-1MG	124
401011-500UG	73
401105-10MG	16
401251-10MG	67
401474-1MG	124
401477-1MG	124
401478-1MG	124
401479-1MG	124
401480-1MG	124
401481-500UG	124
401482-5MG	124
401483-1MG	125
401484-500UG	125
401485-1MG	125
401486-1MG	125
401487-1MG	125
401488-5MG	125
401489-5MG	125
401490-5MG	125
401491-5MG	125
401493-1MG	125
402081-1MG	92
402085-1MG	40
402086-1MG	40
402087-5MG	56
402088-1MG	40
405268-10GM	113
405273-5MG	16
406170-5MG	118
407247-1MG	56
407248-10MG	56
407249-1EA	5
407272-5MG	101
407325-25MG	87
407331-5MG	14
407601-5MG	73
407602-5MG	14
407616-10MG	102
407621-5MG	102
407625-5MG	66
407710-25GM	26

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
407719-25GM	26
407721-10MG	120
407953-2MG	12
410957-250MG	132
410960-25MG	16
410972-25MG	15
412400-10MG	138
412510-10MG	130
412511-25MG	15
412512-25MG	15
416154-10MG	101
416157-1MG	125
416200-5MG	26
419800-5MG	131
419840-25MG	96
420097-500UG	56
420099-1MG	40
420099-500UG	56
420101-5MG	56
420104-5MG	56
420112-1MG	40
420116-1MG	35
420118-1MG	35
420119-5MG	35
420121-10MG	56
420122-10MG	56
420123-1MG	35
420126-5MG	56
420128-5MG	35
420129-5MG	35
420130-1MG	35
420131-1MG	35
420132-25MG	56
420133-2MG	35
420134-2MG	35
420135-5MG	35
420136-5MG	35
420138-1EA	5
420139-5MG	40
420140-5MG	35
420141-10MG	40
420142-10MG	35
420143-5MG	36
420144-10MG	36
420145-25MG	57
420146-10MG	14
420147-10MG	36
420148-5MG	57
420149-25MG	14
420150-10MG	36
420175-10MG	11
420201-5MG	97
420202-5MG	12
420203-10MG	12
420204-10MG	12
420205-10MG	12
420210-1MG	136
420220-10MG	16
420294-10MG	66
420297-100UG	33
420298-100UG	33
420305-1MG	50
420311-5GM	134
420320-50UG	48
420321-50UG	52
420323-50UG	48
420326-25MG	11
420345-25MG	113
420350-10MG	130
420351-10MG	15
420358-25MG	12
420360-10MG	12
420361-10MG	12
420600-50MG	115
421050-5MG	26
422000-1MG	40
422500-1MG	105
422625-10MG	15
422682-5MG	13
422686-1MG	26
422689-5MG	11
422706-1MG	33
422708-1MG	33
422709-1MG	33
422711-1MG	33
422712-1MG	33
422720-5MG	85
426100-200UG	21
426102-100UG	22
428150-1MG	57
428201-5MG	15
428205-1MG	57
428206-5MG	57
428207-5MG	57
431050-5UG	96
434610-25MG	11
434741-20MG	113
435300-5MG	57
435801-25MG	12
435930-10MG	14
438075-10MG	16
438185-25MG	114
438186-5MG	114
438187-5MG	12
438193-5MG	120
438194-10MG	14
438195-10MG	14
438210-10MG	15
440025-5MG	130
440202-5MG	46
440203-1MG	46
440204-1MG	46
440205-5MG	128
440206-5MG	46
441251-1MG	26
444130-25MG	11
444143-1MG	104
444144-10MG	104
444145-10MG	104
444151-1MG	104
444152-5MG	88
444153-10MG	12
444155-10MG	80
444158-10MG	11
444170-1MG	117
444180-1SET	9
444185-1SET	9
444189-1EA	5
444190-1SET	9
444200-1MG	106
444218-5MG	19
444225-5MG	19
444237-1MG	19
444241-5MG	19
444244-10MG	19
444247-1MG	19
444249-1MG	19
444250-10MG	19
444251-1MG	19
444252-1MG	19
444255-1SET	9
444264-1MG	20
444274-500UG	20
444278-500UG	20
444283-1MG	20
444284-5MG	20
444285-500UG	20
444286-5MG	20
444288-5MG	20
444289-5MG	27
444290-2MG	20
444291-5MG	20
444293-10MG	15
444294-10MG	14
444295-25MG	15
444300-1GM	129
444605-250UG	50
444800-100MG	113
444805-10MG	102
444825-10MG	15
444898-1MG	78
444937-1MG	44
444938-5MG	44
444939-1MG	44
444965-5MG	44
444966-5MG	44
444967-5MG	41
444968-5MG	14
445800-25MG	100
445820-5MG	92
445821-5MG	92
445825-100MG	27
445835-10MG	57
448101-1MG	57
448103-5MG	57
448104-5MG	57
448105-2MG	57
448106-5MG	57
453710-1SET	9
454180-10MG	74
454202-10MG	132
454565-1MG	116
454586-10MG	13
454861-5MG	41
454862-10MG	11
454870-10MG	109
457250-1GM	128
459616-25UG	69
459618-50UG	69
459620-25UG	69
466220-100MG	129
472804-10MG	129
474700-50MG	114
474705-5MG	114
474780-5MG	22
474787-10MG	22
474788-10MG	22
474790-1MG	22
474790-5MG	22
474790-10MG	22

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
474790-20MG	22
474791-1MG	22
475730-10MG	109
475741-10MG	118
475825-10MG	11
475837-5MG	99
475838-50MG	74
475840-10MG	132
475843-50MG	20
475846-10MG	99
475847-10MG	16
475856-10MG	120
475857-10MG	14
475859-25MG	12
475863-5MG	41
475864-5MG	41
475877-5MG	87
475879-1MG	78
475880-1MG	45
475882-1MG	45
475886-25MG	129
475889-5MG	115
475949-5MG	88
475954-10MG	104
475956-10MG	101
475957-10MG	101
475965-10MG	101
475981-5MG	45
475984-5MG	16
475986-5MG	44
475988-5MG	44
475990-5MG	44
475991-10MG	14
475992-10MG	14
475995-1EA	11
476275-25MG	46
476475-500UG	50
476480-500UG	50
476485-500UG	48
476490-1SET	9
476495-10MG	33
476496-5MG	101
476880-5MG	31
479775-5GM	69
479830-5MG	102
479975-250MG	115
480025-500UG	125
480026-5MG	14
480030-500UG	125
480060-5MG	87
480065-5MG	87
480066-5MG	87
480073-25MG	11
4801-25GM	116
480100-20ML	116
480150-5MG	102
480403-5MG	69
480404-2MG	15
480415-10MG	109
480420-10MG	109
480457-10MG	125
480458-5MG	15
480850-10MG	13
480870-10MG	57
481406-1MG	125
481407-1MG	126
481408-5MG	126
481411-5MG	126
481412-10MG	126
481414-5MG	126
481417-5MG	14
481480-500UG	126
481486-500UG	126
481487-1EA	5
481908-2MG	132
481919-25MG	109
481920-50MG	13
481984-500MG	66
482100-10MG	129
482210-5MG	113
482251-1UG	70
482740-10MG	11
483125-100MG	129
483400-100MG	129
484100-10MG	113
484235-250MG	129
488004-10MG	14
489476-10MG	96
489477-5MG	96
489478-10MG	12
489479-10MG	12
490070-5MG	129
491002-1MG	123
491207-1GM	93
492000-10MG	130
492002-10MG	130
492030-5MG	128
492031-10MG	13
492041-25MG	11
492042-10MG	11
492910-10MG	11
493800-5MG	131
494105-25MG	14
495320-10MG	128
495455-10MG	78
495604-25UG	70
495609-25UG	70
495620-1MG	92
495621-5MG	92
495624-5MG	92
496000-250UG	121
496100-50MG	78
496150-10MG	87
496265-25MG	87
496915-5MG	126
497985-10MG	128
4995-1GM	79
499609-1MG	126
499610-1MG	126
5.00469.0001	12
5.00486.0001	11
5.00489.0001	12
5.00491.0001	15
5.00495.0001	11
5.00496.0001	16
5.00498.0001	15
5.00499.0001	14
5.00500.0001	15
5.00501.0001	16
5.00502.0001	15
5.00503.0001	12
5.00505.0001	12
5.00507.0001	11
5.00508.0001	12
5.00511.0001	12
5.00517.0001	15
5.00519.0001	15
5.00523.0001	13
5.00526.0001	14
5.00527.0001	13
5.00528.0001	15
5.00554.0001	15
5.00556.0001	16
5.00557.0001	15
5.00561.0001	12
5.00609.0001	11
5.00613.0001	14
5.00614.0001	15
5.00615.0001	11
5.00649.0001	12
5.00653.0001	15
5.00655.0001	15
5.00670.0001	12
5.00671.0001	12
5.00713.0001	14
5.04041.0001	15
5.04043.0001	12
5.04044.0001	15
5.04045.0001	14
5.04120.0001	14
5.04173.0001	15
5.04187.0001	11
5.04191.0001	11
5.04274.0001	13
5.04275.0001	13
5.04276.0001	16
5.04277.0001	14
5.04293.0001	14
5.04297.0001	11
5.04314.0001	15
5.04316.0001	13
5.04317.0001	12
5.04344.0001	12
5.04345.0001	15
5.04359.0001	13
5.04361.0001	15
5.04368.0001	13
5.04373.0001	15
5.04374.0001	11
5.04375.0001	13
5.04376.0001	15
5.04377.0001	11
5.04378.0001	13
5.04379.0001	15
5.04394.0001	13
5.04395.0001	13
5.04396.0001	14
5.04462.0001	11
5.04463.0001	13
5.04466.0001	13
5.04467.0001	13
5.04472.0001	13
5.04479.0001	13
5.04481.0001	13
5.04483.0001	13
5.04519.0001	13
5.04522.0001	13
5.04523.0001	13
5.04528.0001	13
5.04535.0001	11

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
5.04537.0001	11
5.04539.0001	11
5.04594.0001	11
5.04595.0001	14
5.04596.0001	14
5.04597.0001	14
5.04599.0001	16
5.04631.0001	15
5.04632.0001	14
5.04633.0001	13
5.04634.0001	13
5.04635.0001	13
5.04637.0001	13
5.04658.0001	13
5.04660.0001	11
5.04684.0001	13
5.04685.0001	13
5.04712.0001	16
5.04713.0001	13
5.04745.0001	13
5.04746.0001	13
5.04761.0001	13
5.04772.0001	14
5.04776.0001	12
5.04777.0001	14
5.04778.0001	13
5.04793.0001	14
5.04794.0001	14
5.04795.0001	13
5.04815.0001	14
5.04817.0001	15
5.04817.0002	15
5.04819.0001	16
5.04820.0001	13
5.04839.0001	13
5.04840.0001	13
5.04841.0001	13
5.04842.0001	13
5.04843.0001	15
5.04844.0001	13
5.04845.0001	14
5.04904.0001	13
5.04905.0001	13
5.04906.0001	11
5.04907.0001	15
5.04908.0001	14
5.04913.0001	13
5.04914.0001	13
5.04924.0001	12
5.04972.0001	12
5.04973.0001	13
5.04974.0001	14
5.04981.0001	15
5.04983.0001	14
5.05016.0001	13
5.05017.0001	14
5.05018.0001	13
5.05019.0001	13
5.05020.0001	13
5.05021.0001	14
5.05024.0001	13
5.05026.0001	13
5.05027.0001	13
5.05051.0001	13
5.05145.0001	11
5.05146.0001	14
5.05207.0001	13
5.05208.0001	13
5.05222.0001	14
5.05226.0001	13
5.05227.0001	12
5.05228.0001	14
5.05276.0001	15
5.05277.0001	11
5.05278.0001	11
5.05296.0001	13
5.05298.0001	12
5.05299.0001	12
5.05300.0001	14
5.05308.0001	15
5.05311.0001	13
5.05313.0001	13
5.05315.0001	13
5.05316.0001	14
5.05412.0001	13
5.05413.0001	13
5.05414.0001	13
5.05415.0001	13
5.05416.0001	12
5.05417.0001	13
5.05418.0001	13
5.05419.0001	14
5.05477.0001	15
5.05478.0001	13
5.05481.0001	13
5.05483.0001	13
5.05484.0001	14
5.05486.0001	14
5.05626.0001	13
5.05723.0001	14
5.05724.0001	14
5.05732.0001	13
5.05734.0001	13
5.05736.0001	13
5.05757.0001	11
5.05758.0001	13
5.05759.0001	15
5.05762.0001	12
5.05764.0001	13
5.05766.0001	14
5.05771.0001	13
5.05772.0001	14
5.05773.0001	13
5.05816.0001	14
5.05819.0001	15
5.05820.0001	13
5.05821.0001	13
5.05873.0001	13
5.05875.0001	12
5.05877.0001	13
5.05878.0001	13
5.05879.0001	13
5.05880.0001	13
5.05881.0001	13
5.05892.0001	15
5.05894.0001	13
5.05895.0001	13
5.05897.0001	13
5.05980.0001	15
5.05981.0001	14
5.05982.0001	13
5.05983.0001	13
5.05985.0001	11
5.05986.0001	14
5.05988.0001	12
5.05989.0001	14
5.05991.0001	13
5.06044.0001	13
5.06045.0001	11
5.06075.0001	12
5.06125.0001	13
5.06129.0001	13
5.06236.0001	14
5.06239.0001	13
5.06271.0001	13
5.06272.0001	14
5.06291.0001	15
5.06382.0001	13
5.06415.0001	14
5.06417.0001	14
5.06419.0001	13
5.08014.0001	13
5.08015.0001	13
5.08016.0001	13
5.08017.0001	13
5.08018.0001	13
5.08119.0001	14
5.08120.0001	13
5.08146.0001	14
5.08147.0001	14
5.08148.0001	13
5.08149.0001	14
5.08150.0001	13
5.08155.0001	13
5.08159.0001	14
5.08160.0001	13
5.08161.0001	14
5.08162.0001	13
5.08228.0001	15
5.08316.0001	13
5.08317.0001	13
5.08319.0001	13
500586-1SET	15
500587-10MG	12
506101-2MG	45
506102-2MG	45
506106-5MG	45
506121-1MG	42
506126-500UG	42
506132-5MG	87
506134-10MG	87
506148-1MG	42
506153-10MG	42
506154-5MG	98
506155-10MG	98
506156-1MG	42
506157-5MG	42
506158-10MG	42
506161-2MG	42
506163-5MG	42
506169-1EA	6
506170-25MG	98
506172-10MG	42
506173-10MG	14
506174-5MG	14
506190-10MG	22
506274-5MG	116
506282-10MG	130
512732-50MG	126
513000-5MG	42

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
513001-1ML	57
513022-5MG	17
513028-5MG	70
513030-1MG	42
513033-1MG	57
513035-500UG	58
513036-500UG	58
513040-1MG	58
513050-5MG	15
513100-50MG	105
516354-500MG	101
516481-5MG	27
516483-1MG	27
516485-1MG	121
516535-5MG	14
516566-50MG	118
516567-10MG	11
516568-10MG	15
516569-10MG	15
516570-2MG	11
516571-25MG	12
516705-500MG	27
520219-10MG	27
520222-5MG	27
520224-1MG	27
521000-250MG	70
521231-1MG	58
521232-1MG	58
521233-1MG	58
521234-1MG	58
521235-5MG	58
521236-5MG	58
521237-5MG	58
521238-10MG	58
521275-5MG	31
521276-5MG	58
523310-10MG	113
52332-1GM	27
524390-1MG	79
524403-25MG	114
524488-200MG	50
524611-5MG	46
524618-10MG	16
524619-25MG	16
524625-1SET	8
524627-1ML	8
524628-1ML	8
524629-1ML	8
524632-1SET	8
524718-1SET	9
524748-5MG	11
525143-500UG	116
525145-1MG	116
525146-10MG	12
525276-5MG	29
525330-25MG	15
526520-5MG	92
526521-1MG	92
526522-5MG	92
526523-5MG	92
526524-5MG	92
526528-10MG	14
526529-10MG	14
526561-5MG	14
527450-5MG	65
527451-5MG	14
527455-10MG	65
527948-1MG	45
528100-1MG	46
528101-2MG	46
528106-5MG	46
528108-5MG	46
528111-5MG	46
528112-5MG	47
528113-1MG	47
528114-5MG	47
528116-5MG	47
528117-5MG	47
528118-5MG	47
528119-5MG	47
528120-10MG	99
528121-5MG	47
528122-5MG	14
528124-25MG	15
528150-1MG	131
528151-2MG	15
528201-10MG	14
528205-50UG	21
528208-50UG	21
528213-50UG	21
528245-5MG	11
528281-10MG	88
528282-5MG	88
528283-2MG	88
528284-500UG	58
528819-5MG	131
528820-1SET	9
528822-5MG	131
528824-10MG	131
528884-5MG	14
5291-500MG	50
529505-10MG	11
529531-10MG	123
529542-2MG	15
529573-1MG	58
529574-1MG	58
529576-1MG	59
529578-10MG	70
529579-1MG	59
529581-1MG	33
529582-5MG	73
529584-5MG	47
529598-10MG	14
529599-10MG	59
529605-1MG	59
529606-1MG	14
529627-10MG	98
529659-10MG	16
529685-200UG	14
530007-10MG	123
530070-5MG	119
535140-1ML	7
535141-1ML	7
535142-1ML	7
537000-5MG	16
537011-5MG	29
539124-1SET	7
539128-1SET	7
539129-1ML	7
539131-1VL	7
539132-1SET	7
539133-1ML	7
539134-1ML	7
539136-1ML	7
539137-1ML	7
539138-1ML	8
539160-1MG	22
539161-5MG	22
539162-1MG	22
539163-100UG	22
539164-1SET	9
539165-1SET	9
539175-5MG	22
539183-100UG	22
539185-10MG	22
539187-25MG	22
539209-5MG	85
539211-50MG	85
539212-2MG	12
539214-10MG	12
539225-25MG	15
539470-10MG	29
539522-5MG	50
539542-5MG	50
539560-500UG	50
539572-1SET	31
539573-1SET	9
539604-500UG	50
539610-500UG	50
539620-250NG	70
539624-500UG	50
539630-1SET	8
539636-500UG	51
539638-100UG	70
539644-500UG	40
539648-1MG	45
539649-5MG	51
539652-2MG	51
539654-500UG	51
539684-1MG	48
539690-25MG	85
539741-5MG	71
539749-2MG	71
539808-10MG	71
540020-1MG	141
540200-10MG	71
540210-10MG	71
540211-10MG	71
540213-10MG	71
540215-5MG	71
540216-10MG	71
540217-5MG	71
540218-10MG	14
540220-5MG	136
540222-25MG	134
540411-25MG	134
540500-1MG	93
548000-100MG	130
550601-25MG	11
550602-10MG	11
551476-1MG	84
551476-5MG	84
551590-5MG	73
551600-100MG	47
551850-100MG	123
553003-500UG	64
553008-1MG	64
553014-1MG	64
553015-1MG	64
553016-5MG	64

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
553030-25MG	11
553031-10MG	15
553210-100UG	31
553210-1MG	31
553210-5MG	31
553210-10MG	31
553211-500UG	31
553212-1MG	31
553326-10MG	12
553400-500UG	113
553502-5MG	79
553508-5MG	79
553509-10MG	103
553511-10MG	79
553512-10MG	79
553513-10MG	12
553514-10MG	12
553525-25MG	88
553590-2UG	96
554325-25MG	113
554340-10MG	59
554717-5MG	141
554726-25MG	11
554994-10MG	114
554995-10MG	11
555460-25MG	12
555550-1MG	64
555551-5MG	64
555552-500UG	64
555553-10MG	64
555554-1MG	64
555555-5MG	64
555556-5MG	64
555558-25MG	64
556881-2500U	98
557303-1GM	94
557330-5MG	132
557352-10MG	11
557353-5MG	101
557354-5MG	130
557360-1MG	93
557362-1MG	93
557364-5MG	93
557366-10MG	11
557368-1GM	120
557370-10MG	51
557401-50MG	134
557403-10MG	94
557404-5MG	12
557440-500UG	120
557451-10MG	119
557502-100MG	132
557508-1MG	51
557514-1MG	51
557520-500UG	40
557521-500UG	51
557525-1MG	51
557550-1MG	115
559270-25MG	64
559273-10MG	59
559274-10MG	59
559285-1MG	59
559286-5MG	59
559300-1MG	51
559303-5MG	136
559307-1MG	51
559387-1MG	42
559388-1MG	42
559389-1MG	42
559393-1MG	43
559395-1MG	43
559396-500UG	43
559397-1ML	43
559398-1ML	43
559399-1MG	43
559400-1MG	43
559402-1MG	88
559404-500UG	43
559405-1MG	121
559406-1MG	109
559418-100MG	96
565000-1VL	8
565610-5MG	113
565625-1MG	43
565725-5MG	131
565730-5MG	96
565749-1MG	121
565750-1MG	121
565755-1MG	121
565761-1MG	121
565763-5MG	121
565765-1MG	121
565770-5MG	121
565771-250UG	121
565772-5MG	121
565773-5MG	122
565777-5MG	122
565780-500UG	122
565784-5MG	122
565788-1MG	122
565789-500UG	122
565790-1MG	122
565790-500UG	122
565791-10MG	122
565793-5MG	122
565794-500UG	12
565835-10MG	65
565840-10MG	65
565850-10MG	75
565851-50MG	71
565852-10MG	14
566224-10MG	15
566320-5MG	96
566321-1MG	96
566322-5MG	96
566323-5MG	96
566324-5MG	97
566325-500UG	97
566326-5MG	97
566327-10MG	97
566330-10MG	97
566331-10MG	97
566332-10MG	12
566405-1MG	67
566660-1MG	138
566660-5MG	138
567020-50MG	114
567021-5MG	114
567022-5MG	12
567051-2MG	94
567060-500UG	134
567300-1GM	130
567305-5MG	113
567417-10MG	130
567500-5MG	109
567540-5GM	71
567565-1GM	72
567569-10MG	80
567570-10GM	134
567630-5GM	113
56766-5GM	130
5677-5GM	117
567715-1MG	117
567726-10MG	51
567731-10MG	119
567732-10MG	12
567734-10MG	11
567741-5MG	12
567750-5MG	97
567790-5MG	59
567805-1MG	59
567806-5MG	59
567809-1MG	59
567816-1SET	9
567860-10MG	97
568500-5MG	106
569371-250MG	119
569396-100UG	48
569397-1MG	45
569406-10MG	15
569615-10MG	59
570100-5MG	59
570250-5MG	31
5711-100GM	134
572630-500UG	59
572631-500UG	59
572632-1MG	59
572635-1MG	59
572636-500UG	60
572650-5MG	93
572660-500UG	60
572888-5MG	60
573095-1MG	66
573096-1MG	66
573096-5MG	66
573097-10MG	66
573098-10MG	60
573099-25MG	66
573102-10MG	66
573103-5MG	66
573105-5MG	66
573106-1MG	66
573108-10MG	66
573109-25MG	66
573117-5MG	103
573125-10MG	66
573126-25MG	14
573127-5MG	14
573129-5MG	66
573130-5MG	66
573131-10MG	15
573132-10MG	14
574102-5MG	113
574625-50MG	79
574661-10MG	87
574662-10MG	15
574711-5MG	60
574712-1MG	60
574713-50MG	60
574714-2MG	60

カタログ番号順索引

カタログ番号	ページ
574715-2MG	60
574775-500UG	105
575305-5MG	119
575545-10MG	138
575546-10MG	15
575547-25MG	15
579000-100MG	51
579002-5MG	51
579050-1MG	18
579051-1MG	18
579052-1MG	18
579053-500UG	18
580222-10MG	123
580551-50UG	72
580566-10MG	97
580567-5GM	15
581004-150NMOL	99
581011-10MG	99
581810-2MG	60
58346-10GM	134
584223-25MG	15
585970-100MG	75
586005-1MG	79
586006-2MG	12
598226-1GM	134
598510-10MG	19
606015-10MG	15
608050-10MG	103
612080-5UG	21
612084-5UG	21
612085-5MG	60
613450-5MG	111
613550-10MG	11
613551-5MG	12
613560-25MG	99
613570-1MG	126
613571-1MG	126
613810-10MG	72
614005-100MG	134
614305-10MG	12
614310-10MG	12
614316-5MG	12
614350-25MG	138
614852-10MG	100
614853-10MG	12
616370-10MG	29
616371-1MG	29
616373-1MG	43
616382-50MG	29
616387-250MG	117
616399-100KU	29
616400-10MG	75
616404-1MG	43
616451-5MG	67
616452-2MG	67
616453-2MG	67
616454-2MG	67
616456-2MG	67
616458-5MG	67
616459-2MG	67
616461-5MG	67
616463-10MG	67
616464-5MG	67
616466-1EA	6
616468-5MG	123
616520-10MG	11
616521-10MG	11
616522-10MG	11
627609-1MG	84
627610-1MG	84
627624-5MG	29
645890-10MG	79
647925-1MG	97
647926-500UG	97
648450-1MG	60
648451-10MG	15
648485-10MG	14
648492-50MG	12
648493-25MG	11
648494-10MG	12
650345-1MG	29
65035-100MG	29
650357-100MG	29
654164-5MG	98
654255-1MG	86
654256-5MG	86
654257-10MG	86
654270-10MG	16
654271-2MG	103
654380-10MG	105
655200-10MG	48
655203-10MG	73
657021-1SET	9
658390-5MG	60
658395-5MG	60
658400-5MG	60
658401-5MG	60
658403-5MG	61
658408-10MG	61
658411-5MG	61
658425-5MG	61
658452-5MG	43
658460-5MG	61
658548-1MG	61
658550-5MG	61
658551-5MG	61
658552-5MG	61
662005-1MG	43
662006-1MG	43
662009-5MG	43
662015-10MG	138
662035-5MG	117
662041-5MG	117
662056-50UG	23
662086-10MG	23
662088-10MG	23
662089-10MG	23
662105-25MG	23
662125-10MG	23
662140-10MG	23
662141-25MG	23
662142-25MG	15
662210-10MG	23
666125-10MG	15
672315-50MG	66
672999-10MG	79
673000-10MG	103
676377-25MG	120
676380-5GM	97
676480-1MG	61
676481-5MG	61
676483-500UG	61
676484-5MG	61
676485-1MG	62
676487-1MG	62
676489-1MG	62
676492-10MG	62
676493-1MG	62
676494-1MG	62
676495-1MG	62
676496-1MG	62
676500-5MG	62
676501-5MG	62
676502-1EA	5
676503-5MG	62
676504-10MG	62
676505-10MG	62
681500-500UG	93
681535-1MG	75
681625-1MG	45
681629-10MG	45
681635-1MG	45
681636-1MG	45
681637-1MG	88
681640-1MG	88
681641-1MG	88
681647-5MG	123
681666-1EA	6
681667-25MG	11
681668-5MG	138
681669-10MG	139
681671-10MG	139
681672-2MG	139
681673-10MG	139
681674-5MG	139
681675-1MG	47
681676-1MG	47
681679-10MG	139
681685-10MG	16
684500-25MG	132
688000-1MG	65
688001-500UG	65
688002-1MG	65
691400-10MG	94
691550-25MG	130
692000-1MG	43

303 種類の薬理活性のある分子のライブラリー

StemSelect®
Small Molecule Regulators 384-Well Library I

StemSelect® Small Molecule Regulators 384-Well Library I は、303 種類の薬理活性のある分子のライブラリーです。細胞外ドメインを標的とするもの、細胞透過性で細胞内での活性調節に影響を与えるものを含みます。幹細胞、幹がん細胞と通常細胞を比較して細胞死、増殖、分化、遊走や細胞内のシグナリング・分子機能解析にお役立ていただけます。

製品名	カタログ番号	包装単位	希望販売価格
StemSelect Small Molecule Regulators 384-Well Library I	569744-1EA	1EA	弊社照会

製品について

- 303 種類の阻害剤・アゴニスト・インデューサーなどのライブラリーです。
- 384 ウェルに DMSO または H_2O で溶解した 0.1 ～ 100 mM の因子各 50 µL を分注済みです。
- DMSO または H_2O 中で安定です。

添付書類について



- 構造式のデータファイル
- 濃度
- 標的分子
- IC_{50} 値
- CAS 番号
- PubChem Compound ID（リンクつき）
- 阻害剤の説明
- 分子量
- 細胞透過性および ATP 競合情報



Calbiochem®

Merck Millipore is a division of MERCK

Information



抗体カタログ 2014

upstate® CHEMICON® Calbiochem®

upstate、CHEMICON および Calbiochem ブランドの抗体製品に関する最新情報を掲載。

Topics

メルクミリポア抗体の注力領域

- シグナリング
- エピジェネティクス
- 細胞骨格
- ニューロサイエンス
- 幹細胞

用途・反応別の抗体特集

- リン酸化検出抗体
- ChIP 検証済み抗体「ChIP Ab+」
- RIP 検証済み抗体「RIP Ab+」
- FC 蛍光標識抗体「Milli-Mark」

まとめ買いやバルク購入も承ります。

阻害剤関連製品の最新情報はこちらから >>www.merckmillipore.jp/sogaizai

ライフサイエンス関連製品の最新情報を配信

メルクミリポア公式 Facebook ページ
https://www.facebook.com/merckmilliporej

メルクミリポア公式 Twitter アカウント
https://twitter.com/MerckMilliporeJ

メルクミリポア E- メールニュース
http://www.millipore.com/wm

本紙記載の価格・製品構成は諸般の事情により予告なく変更となる場合がありますのであらかじめご了承ください。記載価格に消費税は含まれておりません。
本文中のすべてのブランド名または製品名は特記なき場合、Merck KGaA の登録商標もしくは商標です。Merck Millipore and the M mark are trademarks of Merck KGaA, Darmstadt, Germany.

メルク株式会社
メルクミリポア事業本部 バイオサイエンス事業部
〒153-8927 東京都目黒区下目黒1-8-1 アルコタワー5F
製品の最新情報はこちら www.merckmillipore.jp
お問合せ▶ On-Line:www.millipore.com/jpts Tel: 0120-633-358 Fax: 03-5434-4859
[BIM005B-1403]5K/B