

キナーゼバイオロジーのための生物活性低分子化合物 キナーゼ研究に最適なツールをご提供

キナーゼは標的タンパク質のリン酸化を触媒します。500 種類以上のキナーゼが知られており、細胞の機能を制御し、シグナル伝達経路を仲介しています。私たちは、これらの重要なシグナル伝達経路のさらなる理解を可能にする阻害剤、受容体リガンドおよび製薬会社が開発したツールの提供に取り組んでいます。

キナーゼ活性を調節する有用な低分子生理活性物質のセレクションをご覧ください、次のブレイクスルーにお役立てください。

製品の特徴

ダサチニブ（製品番号 SML2589）

ダサチニブ (Dasatinib) は、非常に強力な pan-Src/Bcr- Abl 阻害作用を有することから、慢性骨髄性白血病 (CML) およびフィラデルフィア染色体陽性の急性リンパ性白血病 (ALL) の経口治療薬です。しかしながら、新しい研究では HIV への使用の可能性が模索されています。最近の研究では、ダサチニブと抗レトロウイルス剤の併用療法が、SAMHD1 のリン酸化を不活性化し、T 細胞の増殖を阻害することにより、HIV-1 潜伏性ウイルスのリザーバーが持続するのを *in vitro* で妨害することが報告されています。この初期の研究は有望であり、HIV への有効性を判断するためには、さらなる臨床試験が必須となるでしょう¹⁾。

1). Rodríguez-Mora S, Spivak AM, Szaniawski MA, López-Huertas MR, Alcamí J, Planelles V, Coiras M. Tyrosine kinase inhibition: a new perspective in the fight against HIV. Curr HIV/AIDS Rep. 2019 Oct;16(5):414-422.

製品番号	製品名	ターゲット キナーゼ	生理活性
SML2219	SGC-AAK1-1	AAK1, BMP2K/BIKE	ATP-competitive kinase inhibitor against AP2-associated protein kinase 1/AAK1 and BMP-2-inducible protein kinase/BIKE/BMP2K
SML1416	KU-60019	ATM	Potent inhibitor of ATM (ataxia telangiectasia mutated) kinase
SML1415	VE-821	ATR	ATP-competitive inhibitor of ATR
SML0268	AZD1152	AURKB	Selective aurora-B kinase inhibitor; anti-cancer agent
SML0511	GNF-5	BCR-ABL	BCR-Abl inhibitor
SML2589	Dasatinib	BCR-ABL	Orally available and highly potent pan-Src/Bcr-Abl inhibitor
SML1027	Imatinib	BCR-ABL, PDGFR, KIT	BCR-Abl inhibitor
5.05021	BMX-IN-1	BMX	Selective, irreversible inhibitor of bone marrow tyrosine kinase on chromosome X
SML1953	GDC-0879	BRAF V600E	Orally active potent Raf inhibitor with V600E B-Raf-selective anticancer activity
S1318	STO609	CAMKK1, CAMKK2	Selective Ca ²⁺ Calmodulin-dependent protein kinase kinase (CaM-KK) antagonist
PZ0383	Palbociclib	CDK4, CDK6	Orally active and highly specific inhibitor against cyclindependent kinase 4 & 6
C5808	Cortistatin A	CDK8, CDK19	Potent and selective probe for CDK8 and its paralogue, CDK19
PZ0186	PF-477736	CHEK1	Potent and selective ATP-competitive inhibitor of Checkpoint kinase 1 (Chk1)
219511	KH-CB19	CLK1, CLK4, DYRK1A	A cell-permeable and potent N-methylindolyl-enaminonitrile inhibitor that acts against CLK1
PZ0328	PF-4800567	CSNK1E	A casein kinase 1e (CK1e) selective inhibitor
SML0929	HS38	DAPK1, DAPK3	ATP-competitive inhibitor of Death-associated protein kinases DAPK1 and DAPK3
SML2274	DDR1-IN-1	DDR1	Potent, selective, type II tyrosine kinase inhibitor against discoidin domain receptor DDR1/2
PZ0335	CP-724714	ERBB2	Potent and selective inhibitor of HER2/ErbB2
5.38776	BLU9931	FGFR4	A potent, selective, and irreversible FGFR4 inhibitor
SML2202	SGC-GAK-1	GAK	ATP-competitive cyclin G-associated kinase (GAK) inhibitor that effectively inhibits Dengue viral entry
SML0531	BIO-Acetoxime	GSK3B	Potent and selective GSK-3a/b inhibitor that reduces invasiveness of gliomas
SML1046	CHIR-99021	GSK3A, GSK3B	Highly potent inhibitor of Glycogen synthase kinase 3
SML1973	NVP-AEW541	IGF1R	Orally available insulin-like growth factor-I receptor inhibitor
PZ0327	PF06650833	IRAK4	An inhibitor of Interleukin-1 receptor-associated kinase 4 (IRAK4)
SML1643	AS2444697	IRAK4	Selective inhibitor of interleukin-1 receptor-associated kinase 4



製品番号	製品名	ターゲット キナーゼ	生理活性
419820	BMS-509744	ITK	Cell-permeable aminothioaryl-thiazolo compound that potently inhibits IL-2-inducible T-cell kinase
PZ0017	Tofacitinib	JAK1, JAK2, JAK3	Potent inhibitor of Janus kinase 3 (JAK3)
SML2628	NVP-BSK805 trihydrochloride	JAK2	Selective, ATP-competitive Janus kinase 2 (JAK2) inhibitor
SML1979	FM-381	JAK3	Potent and selective Janus kinase JAK3 inhibitor that blocks JAK1/JAK3-mediated STAT5 phosphorylation in human CD4+ T-cells
SML1334	WH-4-023	LCK, SRC	Potent and selective inhibitor of the tyrosine kinases Lck and Src
SML2275	TH-257	LIMK1/2	A potent, type III allosteric LIM-kinase (LIMK1 & LIMK2) inhibitor
SML2355	BIX02189	MAP2K	Potent and selective MEK5 inhibitor that targets at the ATP site
SML1638	VX-745	MAPK14	Selective blood-brain barrier penetrant inhibitor of p38 MAPKα
506174	Skepinone-L	MAPK14	Selective inhibitor of the tyrosine kinases Lck and Src with IC50 values of 2 nM for Lck and 6 nM for Src
SML1382	XMD8-92	MAPK7	Potent and selective inhibitor of BMK1/ERK5/MAPK7 and DCAMKL1 (DCLK1) kinases, implicated in tumorigenesis
SML1246	JNK-IN-8	MAPK8, MAPK9, MAPK10	Potent, selective, and irreversible inhibitor of JNK1/2/3
PZ0188	PF3644022	MAPKAPK2	A selective MK2 inhibitor
448106	SGX-523	MET	Potent inhibitor of BMK1/ERK5/MAPK7 and DCAMKL1 (DCLK1) kinases implicated in tumorigenesis
SML0898	MPS1-IN-1	MPS1	Selectively inhibits Monopolar spindle 1 (MPS1)
R0395	Rapamycin	MTOR	A macrocyclic triene antibiotic that binds to and inhibits the molecular target of rapamycin (mTOR)
SML1445	WZ4003	NUAK1, NUAK2	Selective inhibitor of NUAK1 and NUAK2 kinases with an IC50 of 20 nM for NUAK1 and an IC50 of 100 nM for NUAK2
SML1867	NVS-PAK1-1	PAK1	Potent allosteric inhibitor of p21-activated kinase 1, a serine/threonine kinase that is upregulated in many cancers
5.00613	PF-3758309	PAK1, PAK4, PAK5, PAK6	A cell-permeable pyrrolopyrazole that acts as a potent and reversible inhibitor against p21-activated kinases
J4649	JNJ 10198409	PDGFR	ATP-competitive inhibitor of Platelet-Derived Growth Factor receptor tyrosine kinase
SML2672	Tandutinib	PDGFR	Potent receptor tyrosine kinase inhibitor against PDGFRβ, c-Kit, and Flt3
SML0217	GSK2334470	PDK1	Highly specific and potent inhibitor of PDK1
5.09226	GDC-0941	PIK3CA, PIK3CD	Potent, ATP-competitive inhibitor against class IA and class IB PI 3-K kinases
SML2595	AZD1208	PIM1, PIM2, PIM3	Orally available, potent ATP-competitive pan-Pim kinase inhibitor
H139	HA-1077 dihydrochloride	PKA, PKG, ROCK	Inhibitor of cyclic nucleotide dependent- and Rho-kinases
SML2038	RO3280	PLK1	Potent and selective Polo-like kinase 1 inhibitor
SML1960	GSK583	RIPK2	ATP-competitive RIP2 (RIPK2) inhibitor with efficacy against NOD1- and NOD2-dependent pro-inflammatory cytokines release
SML1045	Thiazovivin	ROCK	A Rho Kinase (ROCK) inhibitor that promotes the transformation of fibroblasts into stem cells
Y0503	Y-27632 dihydrochloride	ROCK1, ROCK2	Highly potent, cell-permeable, selective ROCK inhibitor
559286	BI-D1870	RPS6KA1, RPS6KA2, RPS6KA3, RPS6KA6	Selective inhibitor targeting RSK N-terminal kinase domain in an ATP-competitive manner
559285	SL0101	RSK	Targets the N-terminal kinase domain of p90 ribosomal S6 kinase and inhibits RSK kinase activity
SML2568	SML2568	ACK1	A potent and selective inhibitor of Activated CDC42 kinase 1

製品の特徴

タンドゥチニブ（製品番号 SML2672）

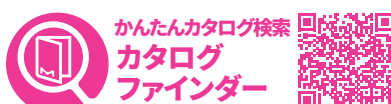
タンドゥチニブ(tandutinib)はPDGFRβ、c-KitやFlt3に対する強力な受容体チロシンキナーゼ阻害剤で、現在、白血病での使用が検討されています。最近の研究では、化学療法の用量制限毒性である好中球減少症を回避するために、タンドゥチニブを含むキナーゼ阻害剤の治療域が調査されました。研究者らは、細胞培養やマウスを用いた実験で、標的とするキナーゼに応じて、あるチロシンキナーゼ阻害剤は好中球に対する毒性が強く、他のチロシンキナーゼ阻害剤は毒性が弱いことを発見しました。今回の複合的なスクリーニング手法は、好中球減少を引き起こす個々の阻害剤を特定するものであり、この結果は*in vivo*でも通用する可能性があるとしています¹⁾。

1). McArthur K, et al. Defining a therapeutic window for kinase inhibitors in leukemia to avoid neutropenia. *Oncotarget*. 2017 Jul;8(35):57948-57963.

バルクサイズ購入で節約

研究用の阻害剤や活性化剤を豊富に取り揃えています。より大規模な実験用に私たちのバルクサービスをご利用ください。大量購入の場合には、よりお求めやすくご提供いたします。また特別なサービスとして、お客様の研究用に便利なパッケージサイズでのカスタマイズ梱包も行っています。

バルクサイズのお問い合わせはこちら <http://bit.ly/bulkscscaleup>



本紙記載の製品は試験・研究用です。ヒト、動物への治療、もしくは診断目的として使用しないようご注意ください。掲載価格は希望販売価格（税別）です。実際の価格は弊社製品取扱販売店へご確認ください。なお、品目、製品情報、価格等は予告なく変更される場合がございます。予めご了承ください。記載内容は2021年6月時点の情報です。Merck, the vibrant M, and Sigma-Aldrich are trademarks of Merck KGaA, Darmstadt, Germany or its affiliates. All other trademarks are the property of their respective owners. Detailed information on trademarks is available via publicly accessible resources. ©2021 Merck KGaA, Darmstadt, Germany. All rights reserved. Original is Lit. No. MK_FL6124EN

シグマ アルドリッチ ジャパン リサーチ事業部

〒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.sigmaaldrich.com/JP/ja

製品に関するお問い合わせは、テクニカルサービスへ
E-mail: jpts@merckgroup.com Tel: 03-6756-8245

在庫照会・ご注文に関するお問い合わせは、カスタマーサービスへ
E-mail: sialjpcs@merckgroup.com Tel: 03-6756-8275 Fax: 03-6756-8301

シグマ アルドリッチ ジャパン合同会社はメルクのグループ会社です。

RBM259-2106-PDF-H