

エピジェネティクス研究用の SGC ケミカルプローブ

私たちは構造ゲノミクス・コンソーシアム (SGC : Structural Genomics Consortium) と提携し、エピジェネティクス研究のための選択性に優れ、特性の明らかなケミカルプローブを提供しています。SGC は、エピジェネティックなシグナル伝達に關与するタンパク質の阻害や拮抗する化学的プローブの開発をリードしてきました。SGC のケミカルプローブは、前臨床ターゲット検証に使用するために効力と選択性に関する厳しい基準を満たしています。SGC の包括的な特性データと私たちの高品質な低分子生理活性物質ポートフォリオに支えられた SGC ケミカルプローブを使用することで、信頼性の高い方法でターゲットを探索することが可能になります。

製品の特徴

GSK343 (製品番号 SML0766)

GSK343 はヒストン H3- リジン (H3K27) のメチル化酵素 EZH2 の酵素活性阻害剤として同定され (IC₅₀ = 4 nM)、EZH2 に対しては EZH1 の 60 倍の選択性、他のヒストンメチル化酵素に対しても 1000 倍以上の選択性を示します¹。最近の研究では、GSK343 による EZH2 の阻害が異常な EZH2 活性から生じるがんに対する新しいコンピナトリアル治療への道を開く可能性が示唆されています²。さらに、GSK343 が EZH2 を阻害することで、正常な造血幹細胞を損なうことなく白血病幹細胞 (LSCs : leukemic stem cells) をアポトーシスに感作させることができ、エピジェネティックな治療法として期待されることも明らかになっています³。

1. Verma, S.K., Tian, X., LaFrance, L.V., Duquenne, C., Suarez, D.P., Newlander, K.A., Romeril, S.P., Burgess, J.L., Grant, S.W., Brackley, J.A., et al. (2012). Identification of Potent, Selective, Cell-Active Inhibitors of the Histone Lysine Methyltransferase EZH2. ACS Med Chem Lett 3, 1091–1096. Chemical Probes for Epigenetics
2. Kim, K.H., and Roberts, C.W.M. (2016). Targeting EZH2 in cancer. Nat. Med. 22, 128–134.
3. Scott, M.T., Korfi, K., Saffrey, P., Hopcroft, L.E.M., Kinstry, R., Pellicano, F., Guenther, C., Gallipoli, P., Cruz, M., Dunn, K., et

製品番号	製品名	生理活性
プロモドメインに対するプローブ		
SML2018*	GSK4027	Cell penetrant, selective PCAF/GCN5 bromodomain inhibitor
SML1524*	(+) JQ1	Selective BET bromodomain probe; BRD4 inhibitor
SML1133	SGC-CBP30	Selective inhibitor of transcription factors CREBBP and EP300
SML2189*	L-Moses	Potent, selective PCAF bromodomain inhibitor
SML0939	PFI-3	SMARCA2/4 and PB1(5) bromodomain inhibitor
メチルトランスフェラーゼに対するプローブ		
U4885	UNC0638	G9a/GLP selective methyltransferase inhibitor
SML1037	UNC0642	Potent G9a/GLP selective methyltransferase inhibitor
SML1410	A-366	Selective inhibitor of the histone methyltransferase G9a
SML1107	SGC0946	Selective H3K79 methyltransferase DOT1L inhibitor
SML0778	UNC1999	Bioavailable inhibitor of EZH2 and EZH1 lysine methyltransferases
SML0766	GSK343	Specific H3K27 methyltransferase EZH2 inhibitor
SML1565	A-196	Inhibits the di- and trimethylation of H4K20me in multiple cell lines
SML1603	BAY-598	Peptide-competitive probe for SMYD2
SML1408*	(R)-PFI-2	Selective SET9 histone-lysine N-methyltransferase inhibitor
SML1555	MS023	Selective Type I protein arginine methyltransferase inhibitor
SML1972*	LLY-283	Selective SAM-competitive PRMT5 inhibitor
その他のエピジェネティックターゲットに対するプローブ		
SML0652	IOX2	Prolyl hydroxylases (PHD) inhibitor
SML0709	GSK-J1	Selective jumonji H3K27 demethylase inhibitor
SML0701	GSK-J4	GSK-1 prodrug; jumonji H3K27 demethylase inhibitor
SML1072	GSK-LSD1	Selective LSD1 inhibitor
SML0067	IOX1	Broad spectrum inhibitor of 2-oxoglutarate oxygenases
SML1658	GSK484	Selective, reversible inhibitor of protein arginine deiminase PAD4
SML1757	GSK864	Selective allosteric inhibitor of isocitrate dehydrogenase 1
SML1923*	A-395	Potent and selective probe for the polycomb protein EED

*Negative control available.

SGC についてはこちら <http://bit.ly/structural-genomics-consortium>

研究には、細胞内の経路を探索するための適切なツールが必要です。エピジェネティックな修飾酵素の小分子調節因子は、クロマチン修飾の生物学的影響を発見するためのツールとなります。遺伝子制御研究におけるターゲットの同定と検証のために、私たちは転写因子モジュレーター、クロマチン修飾酵素の阻害剤、アゴニスト、アンタゴニストなど、さまざまな低分子リサーチツールをご提供しています。これらのリサーチツールの一部を以下にご紹介します。

製品の特徴

GSK1210151A

(製品番号 SML0666)

GSK1210151A は、アセチルリジン認識するクロマチン「アダプター」タンパク質である BET (bromodomain and extra terminal domain protein) ファミリーの阻害剤として機能し、ヒト白血病幹細胞に対して有効性が示されました。具体的には、GSK1210151A は、いくつかの重要な成分をクロマチンから追い出し、その結果、MLL 融合型白血病の病因となることが示唆されている重要な転写因子を阻害することが示されています¹。興味深いことに、BET 阻害剤は抗がん剤としても認識されており、最近の研究では、GSK1210151A が Stat3 経路によって免疫性腫瘍細胞の細胞死を促進することが示唆されています²。

1). Dawson, M.A., Prinjha, R.K., Dittman, A., Giotopoulos, G., Bantscheff, M., Chan, W.-I., Robson, S.C., Chung, C., Hopf, C., Savitski, M.M., et al. (2011). Inhibition of BET recruitment to chromatin as an effective treatment for MLL-fusion leukaemia. *Nature* 478, 529–533.

2). Liu, A., Fan, D., and Wang, Y. (2018). The BET bromodomain inhibitor i-BET151 impairs ovarian cancer metastasis and improves antitumor immunity. *Cell Tissue Res* 374, 577–585.

製品番号	製品名	生理活性
SML0305	3-Deazaneplanocin A hydrochloride	Histone methyltransferase EZH2 inhibitor
A3656	5-Aza-2'-deoxycytidine	DNA methyltransferase inhibitor
A8851	Apicidin	Histone deacetylase inhibitor
SML0567	BRD4770	Selective G9a histone methyltransferase inhibitor
E7034	EX-527	SIRT1 and SIRT6 inhibitor
SML1559	Furamidine	Selective protein arginine methyltransferase 1 inhibitor
SML0666	GSK1210151A	BET bromodomain inhibitor
SML0551	Icaritin	PPARγ inhibitor
662142	P22077	Reversibly inhibits USP7 and USP47 deubiquitylating enzymes
P9879	Procaine HCl	Na ⁺ channel blocker
R2408	Rosiglitazone	PPARγ agonist
SML0061	SAHA	Reversible pan-histone HDAC inhibitor
508320	SAH-EZH2	Selective PRC2 methyltransferase inhibitor
S7817	Scriptaid	Histone deacetylase inhibitor
S8559	Sinefungin	DNA methyltransferase inhibitor
S7942	Sirtinol	Selective sirtuin family deacetylase inhibitor
SML0440	Spautin-1	Inhibitor of USP10 and USP13 deubiquitination
SML0154	SPV-106	Mixed inhibitor/activator of histone acetyltransferases
T8552	Trichostatin A	Potent histone deacetylase inhibitor
SML0065	Tubacin	Selective HDAC6 inhibitor
Z4775	Zebularine	Cytidine analogue; cytidine deaminase inhibitor

低分子生理活性物質の検索はこちら

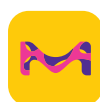
<https://bit.ly/bioactive-small-molecules>

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/bulkscaleup>



サイエンス系
お役立ちメディア
M-hub



かんたんカタログ検索
**カタログ
ファインダー**



メルライフサイエンス - メールニュース
www.merckmillipore.com/wm



メルライフサイエンス公式
SNS、動画コンテンツをご覧ください。

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_FL4394EN Ver. 1.0

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。

RBM261-2106-PDF-H