

# 阻 害 剤

## 活用ハンドブック

作用機序・生理機能などの重要データがわかる

序	秋山 徹 河府和義 ◆	3
本書の構成		◆ 4
阻害剤名 索引		◆ 12

### 第 1 章 プロテインキナーゼ (PKC/PKA/PKG/CK/Rho キナーゼ等) 関連阻害剤

岸田昭世 菊池 章 ◆ 20

1) PKC 阻害剤		Rp-8-Br-cAMPS ◆ 30	D4476 ◆ 35
スタウロスポリン ◆ 23		PKI6-22 amide ◆ 31	DRB ◆ 36
カルホスチン C ◆ 25	3) PKG 阻害剤		5) Rho キナーゼ阻害剤
GF109203X ◆ 26	Rp-8-pCPT-cGMPS ◆ 32		Y-27632 ◆ 38
2) PKA 阻害剤	4) CK 阻害剤		
H89 ◆ 28	CKI-7 ◆ 34		

### 第 2 章 G タンパク質シグナル・セカンドメッセンジャー 関連阻害剤

海川正人 ◆ 40

百日咳毒素 ◆ 43	FTase Inhibitor I ◆ 47	IBMX ◆ 52
コレラ毒素 ◆ 44	GGTI-298 ◆ 49	U-73122 ◆ 54
ボツリヌス C3 酵素 ◆ 45	SQ22536 ◆ 50	
Toxin B ◆ 46	LY-83583 ◆ 51	

### 第 3 章 カルモジュリンキナーゼ関連阻害剤

名田茂之 ◆ 56

KN-93 ◆ 58	CaMK II Inhibitor ◆ 63	ML-7, ML-9 ◆ 67
KN-62 ◆ 59	Lavendustin C ◆ 64	STO-609 ◆ 69
AIP ◆ 60	K252a ◆ 65	W-7, W-5 ◆ 70
CaMK II Ntide ◆ 62	Rottlerin ◆ 66	

**第4章 サイクリン依存性キナーゼ関連阻害剤**

平井 洋 ◆72

ブチロラクトン I	◆75	SU9516	◆83	PD 0332991	◆89
オロモウシン	◆76	NU6102	◆84	CDK2 阻害ペプチド (TAT-LFG)	◆91
ロスコビチン	◆77	NU6140	◆85	CDK2 阻害ペプチド (TAT-LDL)	◆92
プルバラノール A	◆79	JNJ-7706621 とその類 似体 (CDK1/2 inhibitor III)	◆86	ミモシン	◆93
プルバラノール B	◆80	フラボピリドール	◆88		
DRB	◆81				

**第5章 MAP キナーゼシグナル関連阻害剤**

森口徹生 ◆94

1) ERK 経路阻害剤		2) p38 阻害剤		3) JNK 阻害剤	
PD98059	◆96	SB203580	◆99	SP600125	◆103
U0126	◆97	SB202190	◆100	JIP-1 peptide	◆104
FR180204	◆98	SB239063	◆101	AS601245	◆105

**第6章 チロシンキナーゼ阻害剤**

樋口 理 ◆106

Genistein	◆108	K252a	◆110	SU1498	◆113
PP2	◆109	PD153035	◆112	AG490	◆114

**第7章 Wnt シグナル関連阻害剤**

中村 勉 ◆116

NSC 668036	◆119	ICG-001	◆123	塩化リチウム	◆129
PKF115-584	◆120	ケルセチン	◆125	BIO	◆131
CPG049090	◆121	イオノマイシン	◆126	SB-216763	◆132
PNU-74654	◆122	イマチニブ	◆127	SB-415286	◆133

**第8章 Akt キナーゼシグナル関連阻害剤**

藤田直也 ◆134

1) PI3 キナーゼ阻害剤		OSU-03012	◆140	TAT-Akt-in	◆145
LY294002	◆136	3) Akt 阻害剤		Akt-I-1/2	◆146
Wortmannin	◆137	SH-5	◆142	API-59CJ-OMe	◆148
2) PDK1 阻害剤		Perifosine	◆143	Akt Inhibitor X	◆149
UCN-01	◆139	Triciribine	◆144		

## 目次

### 第9章 Notch シグナル阻害剤: $\gamma$ -secretase インヒビター

穂積勝人 ◆ 150

DAPT ◆152	Compound E ◆154	LY411575 ◆156
$\gamma$ -secretase inhibitor VI ◆153	L-685458 ◆155	

### 第10章 プロテインホスファターゼ阻害剤

村田陽二 ◆ 158

オカダ酸 ◆160	シクロスポリン A ◆166	フェニルアルシン オキサイド ◆170
トウトマイシン ◆161	オルソバナジン酸 ◆167	3,4-デホスタチン ◆171
カンタリジン ◆163	ナトリウム ◆169	NSC95397 ◆172
ホストリエシン ◆164	bpV (phen) ◆169	

### 第11章 サイトカインシグナル阻害剤

河府和義 ◆ 174

FK506 ◆177	TGF $\beta$ RI キナーゼ インヒビター ◆182	カイン抗体) ◆184
ラパマイシン ◆178	TNF- $\alpha$ antagonist ◆183	TACE インヒビター ◆186
NFAT インヒビター ◆180	ヘルパー T 細胞分化抑制 抗体群 (抗マウスサイト	トシリズマブ ◆187
サリドマイド ◆181		NF $\kappa$ B デコイ ◆188

### 第12章 ホルモン関連阻害剤

加藤茂明 五十嵐 庸 山岡一良 ◆ 190

ICI-164384 ◆193	ラロキシフェン ◆197	GW9662 ◆202
フルタミド ◆194	RU-486 ◆198	ググルステロン ◆203
ピカルタミド ◆195	TEI-9647 ◆199	
4-OHT ◆196	Ro41-5253 ◆201	

### 第13章 HDAC 阻害剤

河府和義 ◆ 204

トリコスタチン A ◆207	バルプロン酸 ◆210	FK228 ◆214
オキサムフラチン ◆208	トラポキシン ◆211	MS-275 ◆215
ブチラート ◆209	アピシジン ◆212	スルフォラファン ◆216

### 第14章 NF $\kappa$ B 転写因子阻害剤

合田 仁 井上純一郎 ◆ 218

PDTC ◆220	NBD ペプチド ◆226	SN50 ◆233
BAY 11-7082, BAY 11-7085 ◆221	MG-132 ◆228	デキサメタゾン ◆235
BMS-345541 ◆223	ラクタシスチン ◆229	NF $\kappa$ B p65 (Ser276) インヒ ビターペプチド ◆236
PS-1145 ◆224	ボルテゾミブ ◆231	NF $\kappa$ B デコイ ◆238
アスピリン ◆225	DHMEQ ◆232	

**第15章 タンパク質・RNAの核-細胞質間輸送とその阻害剤**

関元敏博 米田悦啓 ◆240

レプトマイシン B ◆242

Ratjadone A ◆243

WGA ◆244

**第16章 カルシウムシグナル・チャネル阻害剤，  
神経系関連阻害剤**

水谷顕洋 ◆246

- |   |                     |                        |
|---|---------------------|------------------------|
| 1) $\text{Ca}^{2+}$ -ATPase 阻害剤                       | 4) 細胞膜カルシウムチャネル 阻害剤 | 6) 神経系関連阻害剤            |
| タプシガルギン ◆248  | SKF-96365, HCl ◆255 | TTX ◆262               |
| CPA ◆249  | 2APB ◆256           | 4-AP ◆263              |
| 2) $\text{Ca}^{2+}/\text{Na}^{+}$ exchanger (NCX) 阻害剤 | 5) 細胞内カルシウム動態阻害剤    | D-AP5 ◆264             |
| SEA0400 ◆251  | BAPTA-AM ◆258       | (+)-MK801 maleate ◆266 |
| 3) 小胞体カルシウムチャネル 阻害剤                                   | A23187 ◆259         | NBQX ◆267              |
| Dantrolene, Sodium salt ◆253                          | イオノマイシン ◆260        | (S)-MCPG ◆268          |
|   |                     | Bicuculline ◆269       |
|   |                     | Nifedipine ◆270        |

**第17章 カスパーゼ，プロテアソーム，グランザイム B などの  
阻害剤**

鎌田真司 ◆272

- |                      |               |                        |
|----------------------|---------------|------------------------|
| 1) カスパーゼ阻害剤          | 3) プロテアソーム阻害剤 | 4) セクレターゼ阻害剤           |
| カスパーゼ特異的阻害剤 ◆274     | ラクタシスチン ◆281  | $\beta$ セクレターゼ阻害剤 ◆284 |
| 汎カスパーゼ阻害剤 ◆277       | MG-132 ◆282   | OM99-2 ◆285            |
| 2) グランザイム B 阻害剤 ◆279 | MG-115 ◆283   | JLK6 ◆286              |

**第18章 マトリックスメタロプロテアーゼ関連阻害剤**

中島元夫 ◆288

- |                 |                  |                 |
|-----------------|------------------|-----------------|
| Marimastat ◆292 | Prinomastat ◆292 | Apratastat ◆293 |
| Tanomastat ◆292 | Trocade ◆292     | ABT 518 ◆293    |
| MMI270 ◆292     | COL 3 ◆293       | ONO 4817 ◆293   |

**第19章 COX，酸化ストレス，NO 関連阻害剤**

川崎善博 ◆294

- |                  |             |                            |
|------------------|-------------|----------------------------|
| スリンダックスルフィド ◆296 | SC-560 ◆302 | L-NMMA ◆309                |
| インドメタシン ◆297     | NS-398 ◆303 | L-NAME ◆310                |
| アスピリン ◆298       | セレコキシブ ◆305 | L-NNA ◆311                 |
| ジクロフェナック ◆300    | EGCG ◆306   | L-NIL Dihydrochloride ◆313 |
| イブプロフェン ◆301     | トロロックス ◆308 |                            |

## 目次

### 第20章 アポトーシスの誘導剤および阻害剤

塩川大介 ◆ 314

スタウロスポリン ◆ 316	ツニカマイシン ◆ 322	デキサメタゾン ◆ 328
アクチノマイシンD ◆ 317	エトポシド ◆ 323	Z-VAD-FMK ◆ 329
シクロヘキシミド ◆ 318	カンプトテシン ◆ 324	Ac-DEVD-CHO ◆ 330
ピューロマイシン ◆ 320	ブレオマイシン ◆ 325	TPCK ◆ 331
タブシガルギン ◆ 321	MNNG ◆ 327	Y-27632 ◆ 332

### 第21章 血管新生阻害剤

安部まゆみ ◆ 334

ベバシズマブ ◆ 337	NK4 ◆ 341	トロンボスポンジン ◆ 347
セレコキシブ ◆ 338	アンジオスタチン ◆ 343	サリドマイド ◆ 349
SU5614 ◆ 339	エンドスタチン ◆ 345	イルソグラディン ◆ 350
SU1498 ◆ 340	2-ME ◆ 346	

### 第22章 細胞骨格・細胞分裂阻害剤－アクチン骨格系

清末優子 大和隆志 ◆ 352

サイトカラシン類 ◆ 355	スウィンホライドA ◆ 360	ウィスコスタチン ◆ 364
ラトランキュリン類 ◆ 357	ファロイジン ◆ 361	BTS ◆ 365
ミカロライドB ◆ 358	ジャスプラキノライド ◆ 363	プレビスタチン ◆ 366

### 第23章 細胞骨格・細胞分裂阻害剤－微小管骨格系

清末優子 大和隆志 ◆ 368

パクリタキセル ◆ 371	ノコダゾール ◆ 376	ドラスタチン 15 ◆ 380
エポチロン類 ◆ 372	ベノミル ◆ 377	モナストロール ◆ 381
コルヒチン類 ◆ 374	ビンカルカロイド類 ◆ 378	トランス-HR22C16 ◆ 383

### 第24章 テロメラーゼ阻害剤

新家一男 ◆ 384

TMPyP4 ◆ 386	GRN163L ◆ 392	テロメラーゼ阻害剤Ⅶ ◆ 398
BRACO-19 ◆ 387	AZT-TP ◆ 393	テロメラーゼ阻害剤Ⅴ ◆ 399
Telomestatin ◆ 388	EGCG ◆ 394	テロメラーゼ阻害剤Ⅲ ◆ 400
12459 ◆ 389	BIBR1532 ◆ 395	PIPER ◆ 401
GRN163 ◆ 391	Geldanamycin ◆ 397	MST-312 ◆ 402

## 第25章 糖プロセッシング阻害剤

新聞陽一 木山亮一 ◆ 404

ツニカマイシン ◆ 406	ベンジル $\alpha$ GalNAc ◆ 409	リン酸オセルタミビル ◆ 416
デオキシノジリマイシン ◆ 407	ミカファンギン ◆ 411	4-MU ◆ 417
デオキシマンノジリマイシン ◆ 408	2-ADN ◆ 412	PDMP ◆ 418
	ボグリボース ◆ 413	
	2-デオキシガラクトース ◆ 415	

## 第26章 主な制癌剤

千葉奈津子 ◆ 420

マイトマイシン ◆ 422	塩酸イリノテカン ◆ 428	プレオマイシン ◆ 435
シスプラチン ◆ 423	アドリアマイシン ◆ 429	クエン酸タモキシフェン ◆ 436
メソトレキセート ◆ 424	アクチノマイシンD ◆ 430	イマチニブ ◆ 438
5-フルオロウラシル ◆ 425	エトポシド ◆ 432	
ハイドロキシカルバミド ◆ 427	パクリタキセル ◆ 433	

## 第27章 DNAポリメラーゼ阻害剤

水野 武 ◆ 440

アフィデコリン ◆ 442	デヒドロアルテヌシン ◆ 446	クルクミン ◆ 450
アラビノスクレオシド ◆ 443	SQMG, SQDG ◆ 447	EGCG ◆ 451
ddTTP ◆ 444	cEPA ◆ 448	PLP ◆ 452
BuPdGTP ◆ 445	リトコール酸 ◆ 449	レスヴェラトロール ◆ 453