

# 決定版 阻害剤・活性化剤ハンドブック

作用点、生理機能を理解して目的の薬剤が選べる実践的データ集

目次

◆序..... 秋山 徹, 河府和義

◆本書の構成..... 4

## 第1章 プロテインキナーゼ関連薬剤 小山浩史, 飯島幹雄, 岸田昭世, 菊池 章 18

<b>1 PKC 関連薬剤</b>	KT5720..... 30	CX-4945..... 40
Bisindolylmaleimide I ... 20	Forskolin..... 31	DRB..... 41
Bisindolylmaleimide II ... 21	8-Br-cAMP..... 32	<b>6 Rho キナーゼ関連薬剤</b>
Bisindolylmaleimide III ... 22	Bucladesine..... 33	Y-27632..... 42
Bisindolylmaleimide IV ... 23	<b>3 PKG 関連薬剤</b>	Fasudil..... 43
Chelerythrine chloride ... 24	KT5823..... 35	Netarsudil..... 44
Staurosporine..... 25	Rp-8-pCPT-cGMPS sodium..... 36	H1152・2HCl..... 45
TPA..... 26	8-pCPT-cGMP sodium ... 37	LPA..... 46
Bryostatin 1..... 27	<b>4 CK1 関連薬剤</b>	<b>7 AMPK 関連薬剤</b>
Phorbol 12, 13-dibutyrate..... 28	D4476..... 38	Dorsomorphin..... 47
<b>2 PKA 関連薬剤</b>	<b>5 CK2 関連薬剤</b>	AICAR..... 48
H89..... 29	A-3 hydrochloride..... 39	A769662..... 49

## 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薬剤 海川正人 51

Pertussis toxin..... 53	Mastoparan..... 58	LY-83583..... 63
NF023..... 54	FTase inhibitor I..... 59	IBMX..... 64
ボツリヌスC3酵素..... 55	GGTI-298..... 60	
Toxin B..... 56	U-73122..... 61	
Cholera toxin..... 57	SQ22536..... 62	

**第3章 カルモジュリンキナーゼ関連薬剤**

藪田紀一, 名田茂之 66

KN-93	68	CaMK II inhibitor	71	ML-7, ML-9	76
KN-62	69	Lavendustin C	72	STO-609	77
AIP	70	K252a	73	W-7, W-5	78
CaMK II Ntide	70	Rottlerin	74		

**第4章 カルシウムシグナル・チャネル, 神経系関連薬剤**

水谷顕洋 80

BAPTA-AM	82	YM 58483	90	GYKI 53655 hydrochloride	97
A23187	83	$\omega$ -Agatoxin IVA	91	(S)-MCPG	98
Ionomycin	84	$\omega$ -Conotoxin GVIA	92	(+)-Bicuculline	99
SEA0400	85	Nifedipine	93	SR141716A	100
CGP-37157	86	(s)-AMPA	94	$\alpha$ -Bungarotoxin	101
Ruthenium red	87	CNQX	95	Tetrodotoxin	102
Xestospongine C	88	NMDA	96		
SKF-96365, HCl	89	D-AP5	97		

**第5章 サイクリン依存性キナーゼ関連薬剤**

川崎善博 103

Palbociclib HCl	105	Olomoucine	108	Purvalanol A	111
Dinaciclib	106	Roscovitine	109	SU9516	112
Flavopiridol	107	Butyrolactone I	110		

**第6章 MAPキナーゼシグナル関連薬剤**

森口徹生 113

**1 ERK1, ERK2 経路関連薬剤**

PD0325901	115
Trametinib	116
SCH772984	117
Dabrafenib	118

**2 ERK5 経路関連薬剤**

BIX02188	119
XMD8-92	120

**3 p38 関連薬剤**

SB202190	121
SB239063	122
Doramapimod	123

**4 JNK 関連薬剤**

SP600125	124
AS601245	125
JNK-IN-8	126

**5 その他 (p38 経路, JNK 経路の活性化因子)**

Anisomycin	127
------------	-----

**第7章 チロシンキナーゼ関連薬剤**

樋口 理 128

Imatinib	130	Vandetanib	133	Sitravatinib	136
Crizotinib	131	Lestaurtinib	134		
Larotrectinib	132	Entrectinib	135		

## 第8章 Aktキナーゼシグナル関連薬剤

藤田直也 138

### 1 Akt 関連薬剤

GSK-690693	140
Perifosine	141
MK-2206	142

### 2 PI3K 関連薬剤

Wortmannin	143
LY294002	144
ZSTK474	146

### 3 PDK1 関連薬剤

UCN-01	147
--------	-----

### 4 PI3K/mTOR 阻害剤

Dactolisib	148
------------	-----

### 5 mTOR 阻害剤 / Akt 活性化剤

Everolimus	150
------------	-----

## 第9章 プロテインホスファターゼ関連薬剤

金野 祐, 村田陽二 152

Okadaic acid	154
Tautomycin	155
Fostriecin	156
Cyclosporin A	157
Sanguinarine chloride	159
CCT007093	160

Cytostatin	161
LB-100	162
Sodium orthovanadate	163
bpV (phen)	164
Phenylarsine oxide	165
BVT 948	166

RK-682	167
NQ301	168
SHPO99	169
MLS000544460	170
TCS401	171
NSC 95397	172

## 第10章 カルシウム以外のイオンチャネル (Na, K, Cl など) 関連薬剤

藪田紀一 174

Anthopleurin A	176
Ouabain	177
Veratridine	178
Tetrodotoxin	179
4-Aminopyridine	180

E-4031	181
Glibenclamide	182
Sotalol	183
NPPB	185
CFTR inhibitor II	186

Chlorotoxin	187
T16Ainh-A01	188
Omeprazole	189
Bafilomycin A1	190

## 第11章 Notch シグナル関連薬剤

穂積勝人 191

DAPT	193
$\gamma$ -secretase inhibitor VI	194

Compound E	194
L-685458	195
LY-411575	196

DBZ	197
-----	-----

第12章 Wntシグナル関連薬剤

中村 勉 198

1 Porcupine 阻害剤

IWP化合物 (IWP-2, IWP-3, IWP-4, IWP-L6, IWP-12, IWP-O1), Wnt-C59, ETC-159, LGK974, GNF-6231 ..... 200

2 Tankyrase 阻害剤

IWR化合物 (IWR-1, IWR-1-endo, 53AH), XAV939, WIKI4 ..... 204

3  $\beta$ -catenin-TCF4 阻害剤

iCRTs ..... 207  
LF3 ..... 208

PNU-74654 ..... 209

4  $\beta$ -catenin-CBP/p300 阻害剤

ICG-001 ..... 210  
Windorphen ..... 211  
IQ-1 ..... 212  
ID-8 ..... 213  
YH249 ..... 214

5 GSK-3  $\beta$  阻害剤

SB-216763 ..... 215  
BIO ..... 216  
CHIR99021 ..... 217  
CHIR98014 ..... 218

TWS119 ..... 218

6 その他の作用点の関連薬剤

Salinomycin ..... 219  
Dvl-PDZ domain inhibitor II ..... 220  
Pyrvinium pamoate ..... 221  
KYA1797K ..... 222  
NCB-0846 ..... 223  
CCT036477 ..... 225  
WAY-262611 ..... 226  
Gallocyanine ..... 226  
HLY78 ..... 227  
SKL2001 ..... 228

第13章 ヘッジホッグシグナル関連薬剤

小松将之, 佐々木博己 230

Cyclopamine ..... 232  
Vismodegib ..... 233  
SANT-1 ..... 234

SAG ..... 235  
20(S)-Hydroxycholesterol ..... 236

GANT61 ..... 237

第14章 サイトカインシグナル関連薬剤

河府和義 238

Rapamycin ..... 240  
Thalidomide ..... 240  
JAK/STAT inhibitor ..... 240

NFAT inhibitor ..... 240  
TGF- $\beta$  RI inhibitor ..... 241  
TNF- $\alpha$  antagonist ..... 242

ヘルパーT細胞分化抑制抗体群 ..... 243  
TACE inhibitor ..... 244  
マウスIL-6中和抗体 ..... 245

第15章 ホルモン関連薬剤

河府和義 246

Dexamethasone ..... 248  
Tretinoin ..... 249  
Fulvestrant ..... 250

Flutamide ..... 251  
4-Hydroxytamoxifen ..... 252  
RU-486 ..... 253

Ro41-5253 ..... 254  
GW9662 ..... 255

## 第16章 トランスポーター, 5-HTなどのGPCRs関連薬剤 藪田紀一 256

Phlorizin .....	258	Phentolamine.....	265	Olanzapine .....	272
WZB 117 .....	259	Baclofen .....	266	Fluvoxamine .....	273
Bumetanide .....	260	Sulpiride .....	267	Atropine sulfate .....	274
Reserpine.....	261	Diphenhydramine .....	268	Cariporide .....	276
Carvedilol .....	262	Cimetidine .....	269		
Propranolol .....	263	Cyproheptadine .....	271		

## 第17章 エピジェネティクス関連薬剤① アセチル化・脱アセチル化 河府和義 278

Trichostatin A .....	280	Trapoxin .....	284	Sulforaphane .....	288
Oxamflatin .....	281	Apicidin .....	285	Anacardic acid .....	289
Butilate.....	282	FK228 .....	286	Garcinol .....	290
Valproic acid .....	283	MS-275.....	287	CTPB .....	291

## 第18章 エピジェネティクス関連薬剤② メチル化・脱メチル化 小松将之, 佐々木博己 292

5-Azacytidine .....	294	GSK126.....	298	BIX01294.....	302	
RG108 .....	295	UNC1999.....	299	GSK-J4 .....	303	
Lomeguatrib .....	296	Pinometostat .....	300	ORY-1001.....	304	
3-Deazaneplanocin A... 297	A-366.....	301	EPZ015666 .....	305		

## 第19章 NF- $\kappa$ B転写因子関連薬剤 合田 仁, 井上純一郎 307

BAY11-7082, BAY11-7085 .....	309	Pyrrolidinedithiocarbamate .....	314	JSH-23 .....	319
BMS-345541 .....	310	PS-1145.....	315	SN50 .....	320
IKK-16 .....	311	SC-514 .....	316	NF- $\kappa$ B decoy oligodeoxynucleotide .....	321
IMD0354 .....	312	TPCA-1 .....	317		
NBD-peptide .....	313	(-)-DHMEQ .....	318		

**第20章 非アポトーシス細胞死関連薬剤**

仁科隆史, 中野裕康 322

Necrostatin-1s	325	Ponatinib	330	Deferoxamine mesylate	335
GSK'872	326	Z-VAD-FMK	331	Trolox	336
Necrosulfonamide	327	Erastin	332	Q-VD-OPh	337
Birinapant	328	Ferrostatin-1	333	IDN-6556	338
BV-6	329	(1S,3R)-RSL3	334	LCL-161	339

**第21章 タンパク質・RNAの核—細胞質間輸送関連薬剤**

宮本洋一, 岡 正啓, 米田悦啓 340

Leptomycin B	342	WGA	344	KPT330	346
Ratjadone A	343	Importazole	345		

**第22章 mRNAスプライシング関連薬剤**

甲斐田大輔 347

Spliceostatin A	349	Isoginkgetin	352	BN82685	355
Pladienolide B	350	TG003	353	Okadaic acid	355
Herboxidiene	351	Chlorhexidine	354		

**第23章 カスパーゼ, プロテアソーム, グランザイムBなど関連薬剤**

鎌田真司 356

**1**カスパーゼ阻害剤

カスパーゼ特異的阻害剤	358
汎カスパーゼ阻害剤	365

**2**グランザイムB阻害剤

グランザイムB阻害剤	366
------------	-----

**3**プロテアソーム阻害剤

Lactacystin	367
MG-115	368
MG-132	369

**4** $\beta$ -secretase阻害剤

$\beta$ -Secretase inhibitor I	370
$\beta$ -Secretase inhibitor II	371
$\beta$ -Secretase inhibitor III	371
$\beta$ -Secretase inhibitor IV	372
OM99-2	373
KMI-429	374

KMI-574	375
KMI-1027	376
KMI-1303	376
AZD3839	377
Lanabecestat	378
LY2886721	379
Verubecestat	380

## 第24章 メタロプロテアーゼ関連薬剤

中島元夫 381

### 1 MMP阻害剤

Marimastat	385
Prinomastat	386
AB0041	387
ヒトTIMP-1	387

ヒトTIMP-2	388
----------	-----

### 2 ADAM阻害剤

INCB3619	389
TAPI-1	390

TAPI-2	391
--------	-----

### 3 ADAMTS阻害剤

ADAMTS-5 inhibitor	392
ADAMTS13 inhibitor	393

## 第25章 COX, 酸化ストレス, NO関連薬剤

川崎善博 394

Acetylsalicylic acid	397
Sulindac sulfide	398
Indomethacin	399
Ibuprofen	400
Diclofenac sodium	401

3-Amino-1,2,4-triazole	402
L-NAME	402
L-NMMA	403
L-NNA	404
L-NIL dihydrochloride	405

Celecoxib	406
Epigallocatechin gallate	406
Sulforaphane	406
Bardoxolone methyl	407
5-Aminolevulinic acid	408

## 第26章 DNA損傷, 修復関連薬剤

塩川大介 410

KU-55933	412
VE-822	413
LY2603618	414
BML-277	415

MK-1775	415
Olaparib	416
SCR7	417
NU-7441	418

Rucaparib	419
Niraparib	420

## 第27章 アポトーシス関連薬剤

塩川大介 421

Pifithrin- $\alpha$	423
BI-6C9	424
NS3694	424
UCF-101	425

Decylubiquinone	426
Salubrinol	427
Aurintricarboxylic acid	427
Bax channel blocker	428

Liproxstatin-1	429
Ferrostatin-1	430
IM-54	430
Necrostatin-1	431

## 第28章 抗生物質

塩川大介 432

Azaserine	434
Mitomycin C	434
Actinomycin D	435
Penicillin G sodium	436

Tetracycline	437
Chloramphenicol	438
Streptomycin sulfate salt	439

Neomycin	440
Cycloheximide	441
Puromycin	442

**第29章 オートファジー関連薬剤**

濱 祐太郎, 森下英晃, 水島 昇 444

Torin 1	446	Bafilomycin A <sub>1</sub>	448	Pepstatin A	451
Rapamycin	447	Chloroquine	449		
Wortmannin	447	E64d	450		

**第30章 糖脂質代謝関連薬剤**

浅井洋一郎, 片桐秀樹 452

2-Deoxy-D-glucose	454	Dapagliflozin	457	Etomoxir	461
Tolbutamide	455	Exenatide	458	Lovastatin	462
5-Aminoimidazole-4-carboxamide ribonucleotide	456	Voglibose	459	Fenofibrate	463
		Ceruleinin	460	Troglitazone	464

**第31章 血管新生関連薬剤**

安部まゆみ 465

Vascular endothelial growth factor	467	Hepatocyte growth factor	469	SU5416	475
Angiopoietin 1	468	Avastin	470	SU6656	476
Fibroblast growth factor 2	468	ZALTRAP	471	NK4	477
		Celecoxib	473	2-Methoxyestradiol	478
		SU5402	474	Thrombospondin	479
				Thalidomide	480

**第32章 細胞骨格・細胞分裂関連薬剤①  
アクチン細胞骨格系**

渡邊直樹, 清末優子 481

Cytochalasins:		Jasplakinolide	490	Mavacamten	499
Cytochalasin B,		Cucurbitacin E	491		
Cytochalasin D	483	Wiskostatin	492		
Latrunculins: Latrunculin A, Latrunculin B	485	CK-666, CK-869	493		
Mycalolide B,		SMIFH2	494		
Trisoxazole-bearing macrolides	486	N-Benzyl-p-toluenesulfonamide	496		
Swinholide A	488	Blebbistatin	497		
Phalloidin	489	Omecamtiv mecarbil	498		

## 第33章 細胞骨格・細胞分裂関連薬剤②微小管骨格系

清末優子 501

<b>1 チューブリン／微小管関連薬剤</b>	Mebendazole, Albendazole	AZ 3146	525
Paclitaxel	514	Mps1-IN-1, Mps1-IN-2	526
Epothilone A, Epothilone B	<b>2 細胞分裂キナーゼ関連薬剤</b>	INH1	528
Colchicine, Demecolcine / Colcemid	Tozasertib	<b>3 モータータンパク質／ダイナミン関連薬剤</b>	
Nocodazole	Alisertib	Monastrol	529
Vinblastine, Vincristine	Barasertib	Ispinesib	530
Eribulin	BI 2536	GSK923295	531
Dolastatin 10, Dolastatin 15	GSK461364	Cilibrevin A / HPI-4, Cilibrevin D	532
Benomyl	NMS-P937	Dynasore	534
	CFI-400945		
	Centrinone, Centrinone-B		

## 第34章 テロメラーゼ関連薬剤

新家一男, 清宮啓之 536

MST-312	$\beta$ -Rubromycin	BRACO-19	548
BIBR1532	Imetelstat	SYUIQ-05	549
(-)-Epigallocatechin gallate	Telomestatin	12459	550
AZT-TP, AZddG	6-Oxazole telomestatin derivative	Phen-DC3	551
Chrolactomycin	TMPyP4	Geldanamycin	552

## 第35章 老化(細胞レベル・個体レベル) 関連薬剤

坂本明彦, 丸山光生 554

Resveratrol	Nicotinamide	Navitoclax	560
SRT1720	mononucleotide	Dasatinib	561
Nicotinamide riboside	Metformin	Quercetin	562
	Rapamycin	Ruxolitinib	563

## 第36章 糖プロセッシング関連薬剤

木山亮一, 新聞陽一 565

Tunicamycin	Micafungin	4-Methylumbelliferone	
1-Deoxynojirimycin	2-Acetamido-1,2-dideoxynojirimycin	PDMP	577
1-Deoxymannojirimycin	Voglibose	Brefeldin A	578
Benzyl-2-acetamido-2-deoxy- $\alpha$ -D-galactopyranoside	2-Deoxy-D-galactose	Castanospermine	579
	Oseltamivir phosphate	Kifunensine	580
		Swainsonine	581

**第37章 抗ウイルス関連薬剤**

鈴江一友 582

Aciclovir	583	Amantadine	584	Raltegravir	586
Oseltamivir	584	Favipiravir	585	Maraviroc	587

**第38章 制がん剤**

千葉奈津子 588

Cisplatin	590	Irinotecan hydrochloride	594	Bleomycin	597
Methotrexate	591	Adriamycin	595	Tamoxifen citrate	598
5-Fluorouracil	592	Etoposide	596	Olaparib	599
Hydroxycarbamide	593				

**第39章 免疫チェックポイント関連薬剤**

山下万貴子, 北野滋久 600

Ipilimumab	602	Pembrolizumab	603	Durvalumab	604
Nivolumab	602	Atezolizumab	604	Avelumab	605

**第40章 DNAポリメラーゼ関連薬剤**

水野 武, 栗山磯子 606

Aphidicolin	608	Cholecalciferol	612	Neobavaisoflavone	615
BuPdGTP	609	Vitamin B6	613	Heptelidic acid	615
CD437	610	HMF	613	5-Methylmellein	616
Curcumin	610	Conjugated eicosapentaenoic acid	614	Resveratrol	617
Menadione	611			Dehydroaltenusin	617

**第41章 ES細胞・iPS細胞関連薬剤**

川瀬栄一郎 619

CHIR99021	621	PS48	625	Go6983	629
PD0325901	622	Rapamycin	626	XAV939	629
RepSox	623	Y-27632	627	IWR-1-endo	630
SB431542	624	Bisindolylmaleimide I	628	YM155	631
A-83-01	624			PluriSiN #1	632

◆索引 ..... 634