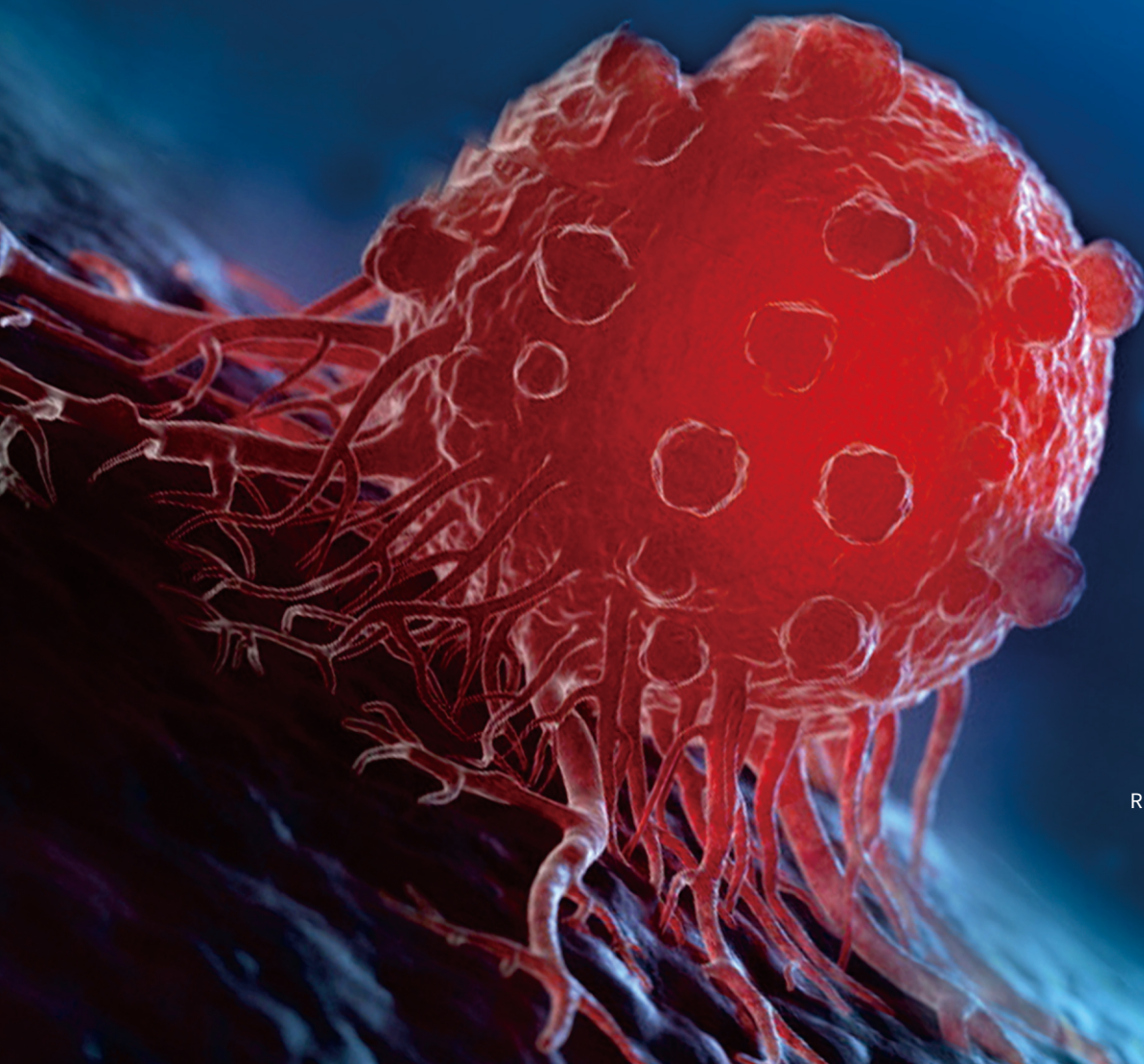


肿瘤研究

Tumor Research



INHIBITORS & AGONISTS



COMPOUND LIBRARIES



NATURAL PRODUCTS



RECOMBINANT PROTEINS



TECHNICAL SERVICE





INHIBITORS & AGONISTS | COMPOUND LIBRARIES | TECHNICAL SERVICE
RECOMBINANT PROTEINS | NATURAL PRODUCTS

www.targetmol.cn



CONTENT 目录

肿瘤研究相关产品和服务	01
...	
肿瘤与肿瘤治疗	02
...	
肿瘤热门研究方向	03
...	
更多肿瘤相关产品	13
...	
产品应用案例	20
...	
产品文献引用	23

肿瘤研究相关产品和服务

Products and Services



10,000+ 种肿瘤治疗相关化合物

我们提供种类齐全, 专业质检, 性价比高的产品, 包括小分子化合物、天然产物、抗体抑制剂等。



1,000+ 种肿瘤相关靶点的重组蛋白

我们的产品可选择不同种属、标签、表达系统, 可用于体内外实验研究, 满足各类实验需求。



100+ 种肿瘤相关化合物库

我们的化合物库分类严谨, 定期更新, 包括已知活性库、天然产物库、类药多样性化合物库等, 同时支持个性化定制库。



丰富的肿瘤研究实验相关试剂盒和技术服务项目

我们的筛选模型丰富、实验科学、操作严谨, 确保结果可信, 助力肿瘤药物发现全流程。



WINNER

TARGETMOL

BIOCHEMICAL SUPPLIER TO WATCH IN 2023



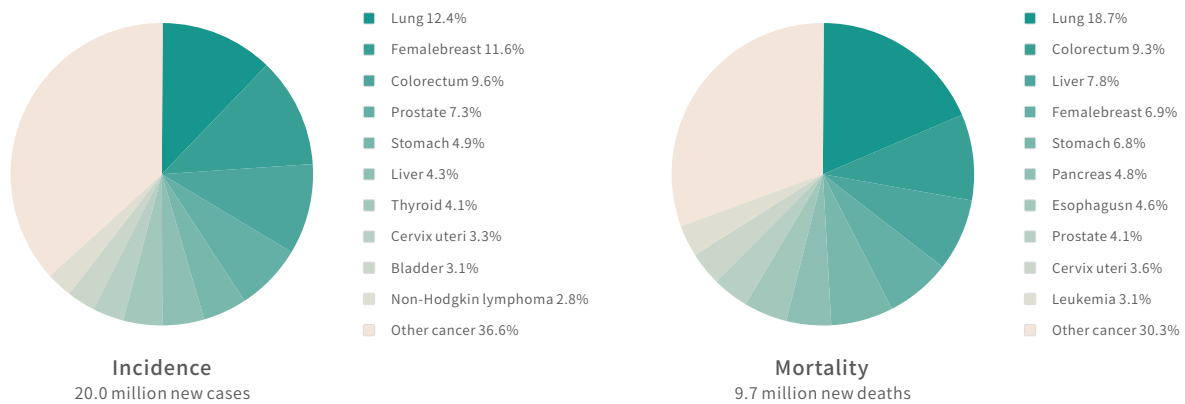
CiteAb

TUMOR

肿瘤与肿瘤治疗

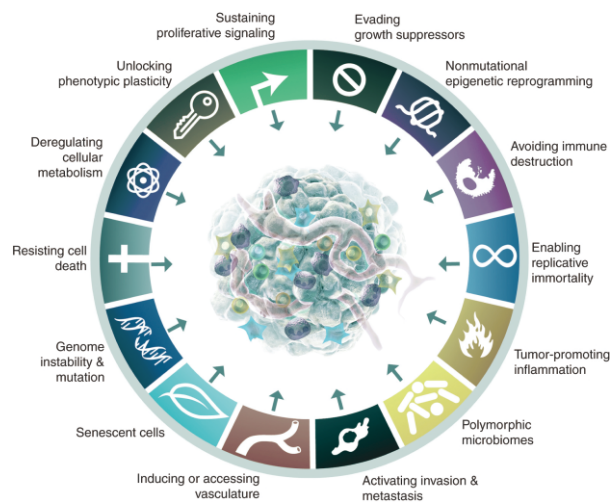
Tumor And Tumor Treatment

肿瘤是对人类健康产生巨大影响的重要疾病，也是全球第二大常见的死亡原因。根据 CA 杂志发布的最新全球癌症统计报告显示，2022 年全球新发癌症病例接近 2000 万，而癌症导致的死亡人数约 970 万。其中，肺癌是全球发病率最高的癌症，其次是女性乳腺癌、结直肠癌、前列腺癌和胃癌。而死亡率最高的癌症则分别是肺癌、结直肠癌、肝癌、女性乳腺癌和胃癌。



2022年癌症的发病率和死亡率分布^[1]

最新研究认为，肿瘤具有 14 种标志性特征，基于对肿瘤研究的不断深化，肿瘤治疗方法也持续发生演变。目前，肿瘤治疗主要包括三大方法：外科治疗、放射治疗和药物治疗。其中，药物治疗经历了三次革命，为肿瘤患者带来了更多的治疗选择。第一次革命开拓了化学治疗领域，以氟尿嘧啶、顺铂、紫杉醇等为代表的化疗药物得到了快速发展。第二次革命引入了靶向治疗策略，基于 EGFR、ABL、CDK 等靶点开发出了一系列分子靶向药物，特异性高、疗效显著且副作用小。第三次革命则创新了免疫治疗手段，目前已有 20+ 款免疫检查点抑制剂上市，包括 PD-1、PD-L1、CTLA-4 药物等。



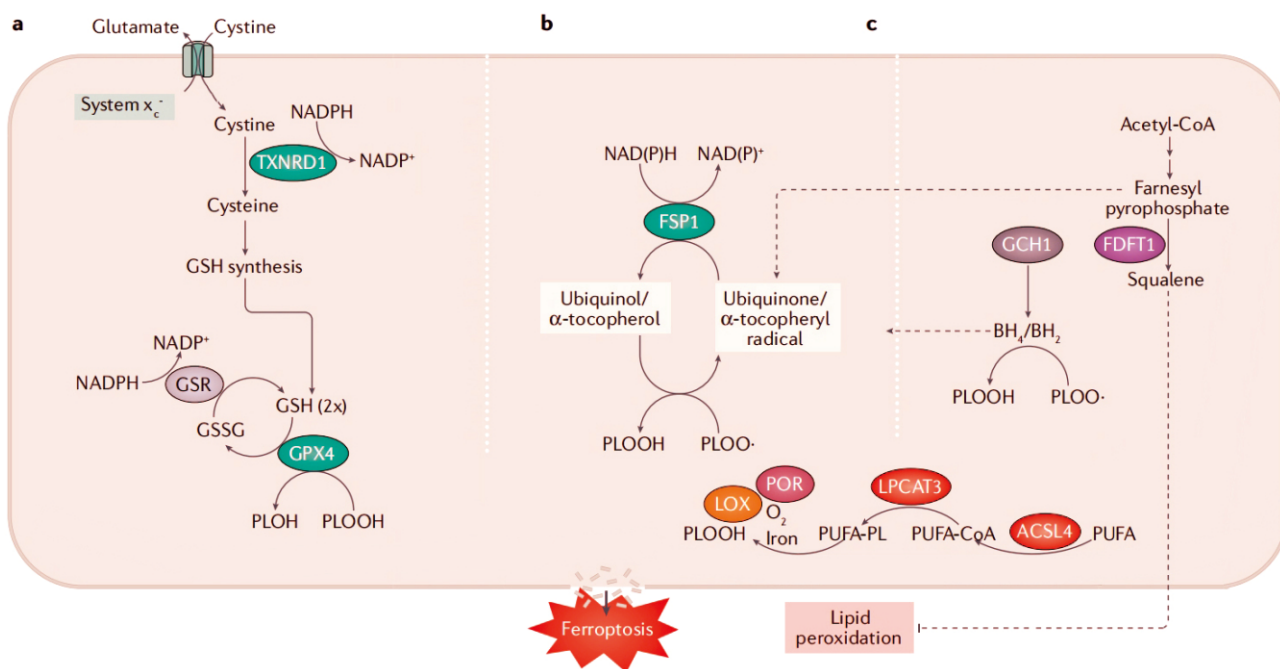
癌症的标志性特征^[2]

肿瘤热门研究方向

Popular Research Directions

1、铁死亡与肿瘤

铁死亡是铁依赖性的磷脂过氧化驱动的一种细胞死亡方式，其机制涉及氧化还原稳态、铁代谢、线粒体活性，以及氨基酸、脂质、糖的代谢等过程。癌细胞通常表现出多重药物抗性，因此易于通过铁死亡途径受到影响，尤其是处于间充质状态且易于转移的肿瘤细胞。因此，通过调节铁死亡的诱导或抑制，在治疗耐药性肿瘤疾病中可能具有巨大的潜力。

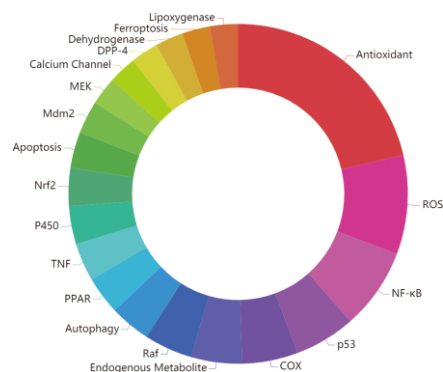


铁死亡的抑制途径^[3]

➤ 铁死亡化合物库 —— L8700

铁死亡化合物库，收集了 700+ 种与铁死亡通路相关的化合物，靶点包括 GPX4、ROS、P53、Nrf2 等，另外还包含了铁螯合剂、抗氧化剂等多种类型小分子。其中部分化合物已被 FDA 批准上市，生物活性和安全性良好。所有化合物均使用 NMR、HPLC/LCMS 等多种技术进行质量检测，保证产品结构正确，纯度高，减少假阳性。

TargetMol 铁死亡化合物库可用于高通量和高内涵筛选，助力您铁死亡通路相关的靶点鉴定和药物研发。

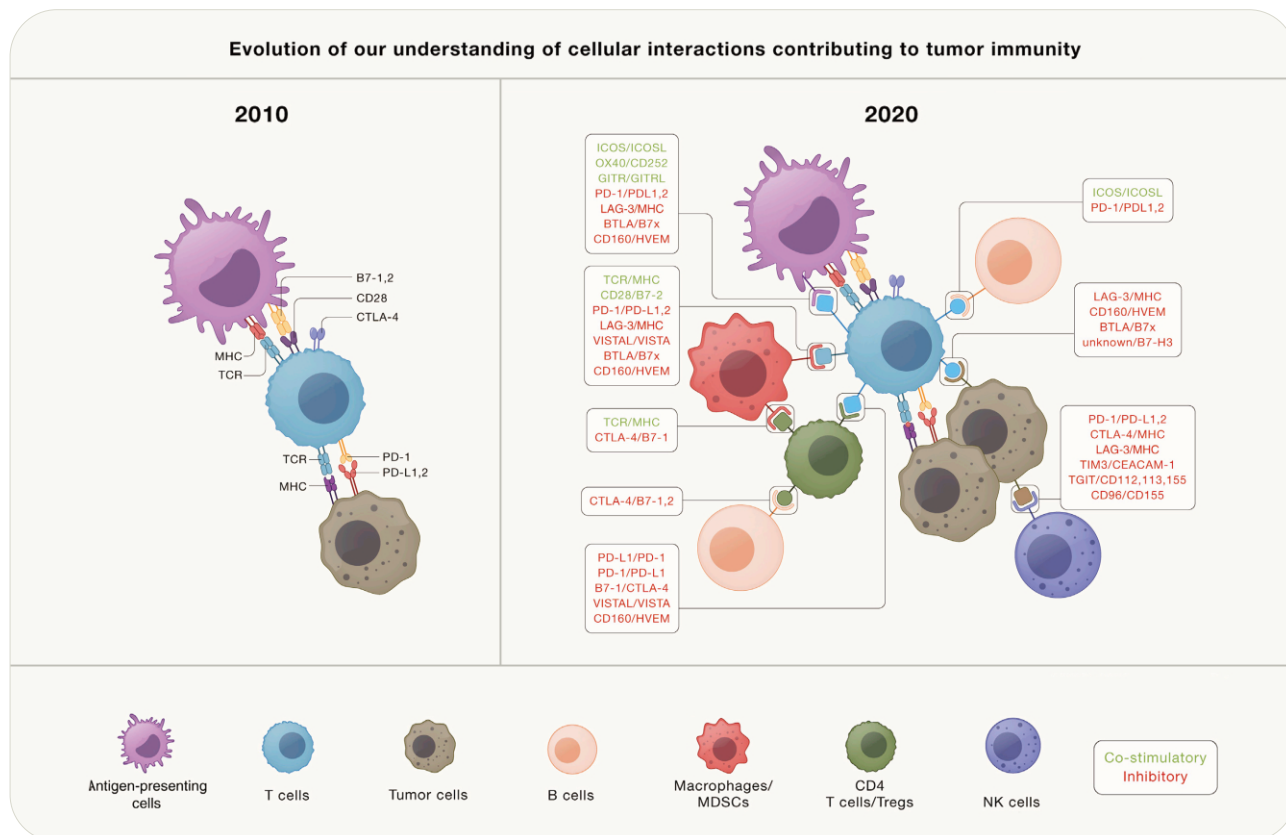


➤ 铁死亡与肿瘤相关化合物

编号	名称	产品介绍
T1765	Erastin	Erastin 是一种 ROS 和铁依赖性的作用于线粒体 VDAC 的铁死亡激活剂,具有抗肿瘤活性,选择性作用于 RAS 致癌突变的肿瘤细胞。
T3646	RSL3	RSL3 (RSL3 1S) 是一种 GPX4 的抑制剂,一种不依赖 VDAC 的铁死亡激活剂,对携带致癌 RAS 的肿瘤细胞具有选择性。
T77745	N6F11	N6F11 是一种新型且具有选择性和有效性的铁死亡诱导剂,通过与癌细胞中的 TRIM25 结合从而促进 GPX4 降解,具有抗肿瘤活性。
T77755	GPX4-IN-5	GPX4-IN-5 是一种小分子共价 GPX4 抑制剂,可促使铁死亡,具有抗肿瘤活性,可用于预防和治疗三阴性乳腺癌 (TNBC)。
T0787	Butylhydroxyanisole	Butylhydroxyanisole 是一种抗氧化剂,也是一种铁死亡诱导剂,能导致大脑和神经发育中断,具有神经毒性。
T5523	Imidazole ketone erastin	Imidazole ketone erastin 是一种铁死亡诱导剂,对 system Xc-胱氨酸/谷氨酸转运蛋白具有抑制作用,具有抗肿瘤活性。
T20819	Ammonium iron (III) citrate	Ammonium iron(III) citrate 是一种非运铁蛋白结合的铁的生理形式,会引起的细胞内铁超负荷从而导致细胞铁死亡,能增强蛋白质产生。
T60202	MMRi62	MMRi62 是一种铁死亡诱导剂,靶向 MDM2-MDM4,对胰腺导管腺癌细胞显示出 p53 独立的促凋亡活性,并诱导其自噬。
T11631	iFSP1	iFSP1 是一种强效、选择性和谷胱甘肽独立的铁死亡抑制蛋白 1 (FSP1) 抑制剂,能够使多种人类癌细胞系对铁死亡诱导剂敏感。
T1637	Deferoxamine Mesylate	Deferoxamine Mesylate 是一种铁螯合剂和铁死亡抑制剂,可将游离铁结合成稳定的复合物,可以上调 HIF-1 α 水平,诱导细胞凋亡。
T2376	Liproxstatin-1	Liproxstatin-1 是一种铁死亡抑制剂,具有强效性和选择性,以保护细胞免受铁死亡诱导剂 (如 Erastin、RSL3) 诱导的铁死亡。
T7092	NADPH tetrasodium salt	NADPH tetrasodium salt 是电子受体烟酰胺腺嘌呤二核苷酸磷酸的还原形式,在各种生物反应中充当电子供体,是一种内源性铁死亡抑制剂。
T3109	Sp600125	SP600125 是一种 JNK 抑制剂,具有口服有效性、可逆性和 ATP 竞争性,也是一种有效的铁死亡抑制剂,可以抑制自噬,诱导凋亡。
T8922	SRS11-92	SRS11-92 是一种铁死亡抑制剂和 Ferrostatin-1 的衍生物,抑制 Erastin 诱导的 HT-1080 人纤维肉瘤细胞铁致细胞死亡。
T77765	FSEN1	FSEN1 是一种新型高效的非竞争性 FSP1 抑制剂,通过抑制 FSP1 诱导癌细胞中的铁死亡,可用于预防和治疗癌症。
T9073	SRS16-86	SRS16-86 是一种铁死亡抑制剂,可研究肾缺血再灌注损伤和脊髓损伤,在体内比 Ferrostatin-1 更稳定。
T4066	FIN56	FIN56 是一种铁死亡特异性诱导剂,能结合并激活角鲨烯合酶,可通过诱导 GPX4 降解来诱导铁死亡。
T4309	CIL56	CIL56 是一种选择性铁死亡诱导剂,可通过产生铁依赖性活性氧来诱导细胞铁死亡。
T6500	Ferrostatin-1	Ferrostatin-1 是一种铁死亡抑制剂,具有强效性和选择性,还具抗氧化和抗真菌活性。
T5343	UAMC-3203	UAMC-3203 是一种有效的选择性铁死亡抑制剂,IC ₅₀ 为12 nM。

2、免疫检查点与肿瘤

免疫检查点是一类免疫抑制性分子，它们在免疫细胞上表达，并能调节免疫激活的程度。这些分子对防止自身免疫作用的发生起着重要作用，然而，一些肿瘤可以通过刺激免疫检查点靶点来保护自身免受免疫攻击。基于程序性死亡受体及其配体的免疫检查点阻断疗法通过抑制程序性死亡受体及其配体的结合，从而提高宿主免疫系统对肿瘤细胞的攻击性。



有助于肿瘤免疫的细胞相互作用^[4]

免疫检查点与肿瘤相关化合物库

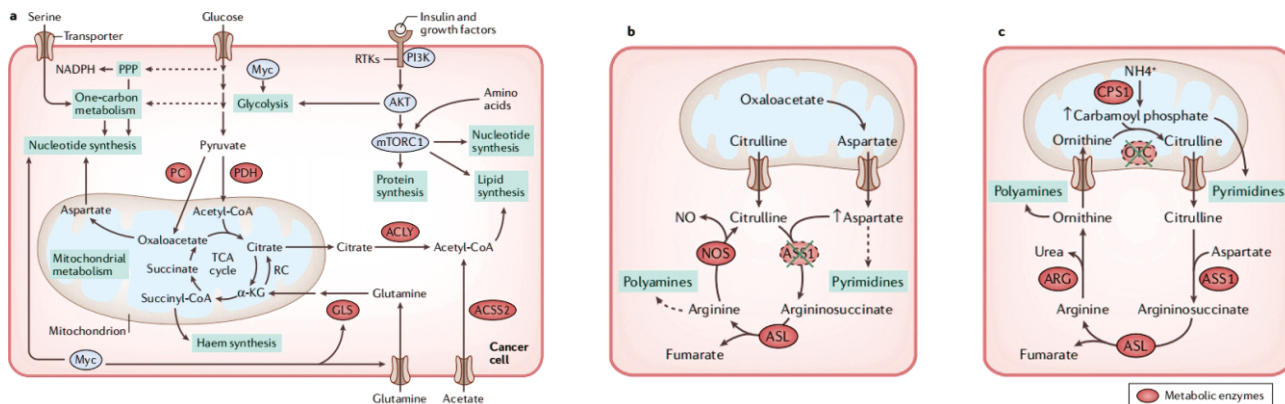
编号	名称	数量	产品介绍
L2170	肿瘤免疫治疗小分子化合物库	400+	靶向肿瘤免疫治疗靶点的小分子集合,可用于高通量和高内涵筛选,是研究肿瘤免疫治疗的有力工具。
EN2800	免疫-肿瘤化合物库	52900+	旨在发现免疫肿瘤治疗领域的新型候选药物;特别关注了 PD-1、CTLA-4、CD152、CD279/74 和 PD-L1 等检查点蛋白。
LF9600	免疫-肿瘤筛选化合物库	3700+	专注于一系列已建立和新兴的免疫肿瘤学靶点,包括:TDO、CD73、精氨酸酶-1、IDO1、GCN2、一氧化氮合酶。
DP2450	PD-1/L1 化合物库	500+	PD-1/L1 相关小分子化合物的集合,是研究免疫肿瘤学和早期药物发现的有用工具。

免疫检查点与肿瘤相关化合物

编号	名称	产品介绍
T3655	BMS-1	BMS-1 是一种 PD-1/PD-L1 蛋白质/蛋白质相互作用的抑制剂, IC50 为 6 到 100 nM。
T3146	BMS-202	BMS-202 是一种非肽类 PD-1/PD-L 复合物抑制剂, 与 PD-L1 直接结合并阻断人类 PD-1/PD-L 的相互作用, 具有抗肿瘤活性。
T9616	PD-1/PD-L1-IN-10	PD-1/PD-L1-IN-10 是一种口服有效的 PD-1/PD-L1 抑制剂, 显示出抗肿瘤活性。
T9902	Atezolizumab	Atezolizumab 是一种人源化单克隆抗体 IgG1, 阻断 PD-L1 与 PD-1 的相互作用, 可用于肿瘤研究。
T9903	Avelumab	Avelumab 是人 IgG1 抗 PD-L1 单克隆抗体, 具有潜在的抗体依赖性细胞介导的细胞毒性作用。
T9907	Nivolumab	Nivolumab 是 PD-1 抗体类抑制剂, 可用于研究晚期 (转移性) 非小细胞肺癌。
T9908	Pembrolizumab	Pembrolizumab 是一种人源化单克隆抗体 IgG4, 在晚期非小细胞肺癌患者中具有抗肿瘤活性。
T11126	Durvalumab	Durvalumab 是一种人源化的抗 PD-L1 蛋白单克隆抗体, 常与铂类化合物联合一起用来治疗非小细胞肺癌和晚期肝癌细胞。
T37535	Camrelizumab	Camrelizumab 是一种具有高亲和力且针对 PD-1 的人源 IgG4-κ 单克隆抗体, 具有抗肿瘤活性和耐受性。
T76750	Cemiplimab	Cemiplimab 是一种针对 PD-1 的人单克隆抗体, 可阻断 PD-1/PD-L1 介导的 T 细胞抑制, 可用于转移性癌症和鳞状细胞皮肤癌研究。
T35394	Sintilimab	Sintilimab 是一种人源化的 IgG4 单克隆抗体, 具有显著的抗肿瘤活性, 通过与 PD-1 结合从而阻断 PD-1 与其配体的相互作用。
T78269	RMP1-14	RMP1-14 是一种 IgG1 样免疫球蛋白抗小鼠 PD-1 抗体, 可阻断 PD-1/PD-L1 信号传导。
T9906	Ipilimumab	Ipilimumab 是全人类单克隆抗体 IgG1κ, 能够抗 CTLA-4, 具有抗肿瘤活性。
T77466	Tremelimumab	Tremelimumab 是一种 CTLA-4 阻断抗体, 常与 Durvalumab 联合使用来治疗肝癌、肺癌等实体癌。
T9901 A-001	Relatlimab	Relatlimab 是一种靶向人抗 LAG-3 的单克隆抗体, 可阻断 LAG-3/MHC II 的相互作用, 常与 Nivolumab 一起用来治疗晚期黑色素瘤。
T76699	Sabatolimab	Sabatolimab 是一种靶向 TIM-3 的人源化 IgG4 抗体, 是一种有效的调节适应性和先天免疫反应的抑制性受体。
T77149	Cobolimab	Cobolimab 是一种有效的 TIM-3 单克隆抗体, 诱导 TIM-3 的内化, 具有抗肿瘤活性, 可用于研究晚期/转移性黑色素瘤和晚期肝细胞癌。
T35391	Vibostolimab	Vibostolimab 是一种抗 T 细胞免疫蛋白和 ITIM 域 (TIGIT) 的单克隆抗体, 显示出抗肿瘤活性, 可用于研究非小细胞肺癌 (NSCLC) 和黑色素瘤。
T35392	Tiragolumab	Tiragolumab 是一种靶向 T 细胞免疫球蛋白和 ITIM 结构域 (TIGIT) 的单克隆抗体, 常与 PD-L1 抑制剂 Atezolizumab 联合使用来治疗恶性肿瘤。
T76696	Onvatilimab	Onvatilimab 是一种人 IgG1κ 抗 VISTA (T 细胞激活的 V 域 Ig 抑制剂) 单克隆抗体, 具有抗肿瘤活性, 可用于治疗晚期头颈癌。

3、代谢与肿瘤

代谢重编程既是肿瘤发展的结果,也是肿瘤进展的重要推动因素,并对肿瘤的治疗有着重要影响。在此过程中,肿瘤细胞会主动适应性地改变其多种代谢途径的流量,以满足其能量产生和生物合成的需求,并减轻肿瘤细胞的氧化应激反应。当代代谢产物异常积累时,也可促进肿瘤的发生(如IDH突变型肿瘤)。在过去几十年中,研究人员揭示了大量维持肿瘤生长的新代谢途径。



支持肿瘤产生的代谢相关信号通路^[5]

代谢与肿瘤相关化合物库

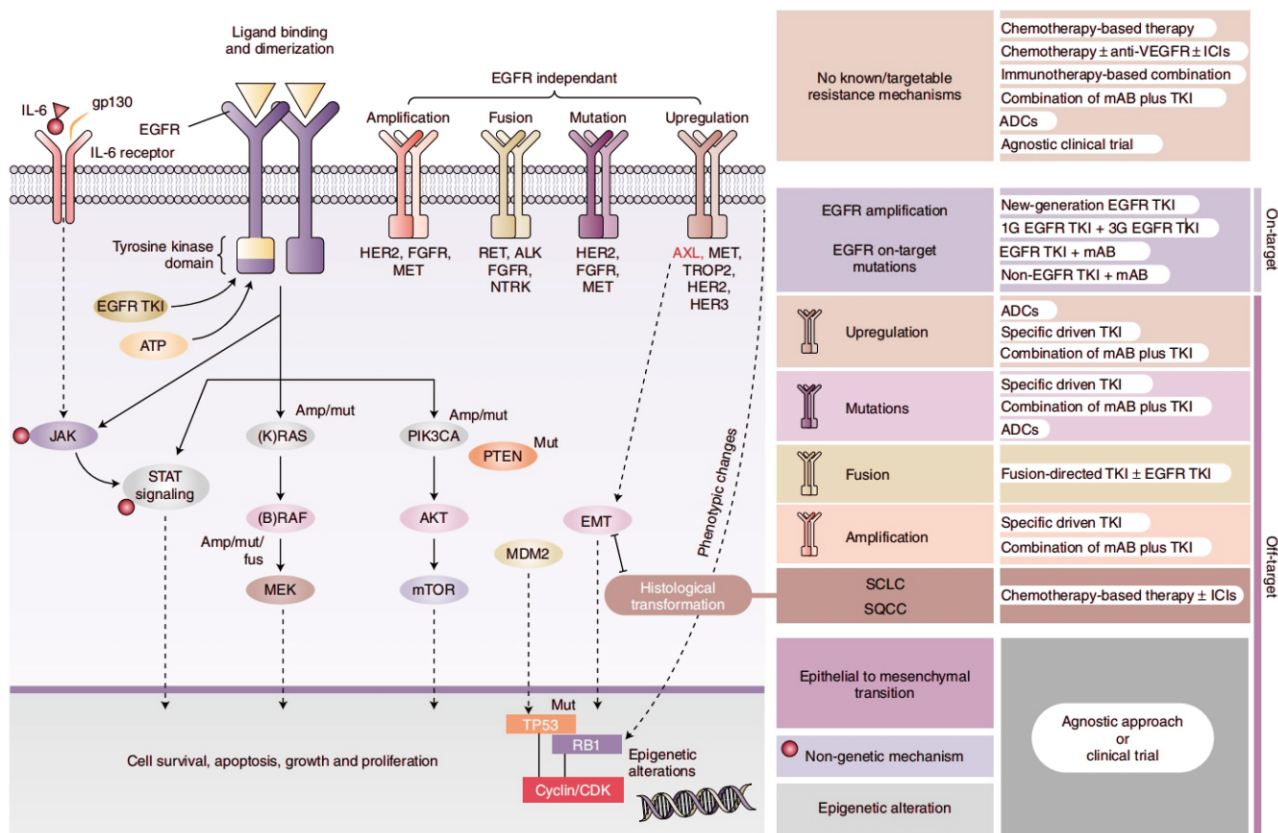
编号	名称	数量	产品介绍
L2560	代谢化合物库	2300+	代谢途径相关生物活性小分子化合物的特有集合,用于高通量、高内涵筛选;靶向糖代谢、脂质代谢、核苷酸代谢等多个代谢途径;涵盖 GLUT、Hexokinase、Pyruvate Kinase 等代谢相关热门靶点。
L2130	抗癌细胞代谢库	1200+	癌细胞代谢相关的生物活性小分子化合物的特有集合,用于肿瘤相关的研究以及抗肿瘤药物的筛选,用于高通量、高内涵筛选;是肿瘤发生机理研究、抗肿瘤药物筛选的有效工具。
L2500	人内源代谢化合物库	500+	人源性代谢产物的独特集合,可用于高通量、高内涵筛选;部分产品已上市或进入临床,具有生物安全保障和良好的生物活性;种类多样,信息详细。
L2520	糖代谢化合物库	700+	糖代谢相关的化合物,可用于高通量和高内涵筛选;作用靶点包含 GLUTs、Hexokinase (HK)、Pyruvate Kinase (PK)、phosphofructokinase (PFK)、IDH1/2、LDH、AMPK 等糖代谢相关靶点。
L2550	谷氨酰胺代谢化合物库	500+	谷氨酰胺代谢相关的分子,可以用于高通量和高内涵筛选;研究谷氨酰胺代谢和癌症的有效工具;靶点包括 glutaminase (GLS)、ASCT2、glutamate dehydrogenase、c-Myc 等。
L7000	活性脂质化合物库	300+	脂质相关的小分子化合物,用于高通量、高内涵筛选;靶点包括 GPCR、HDAC、PPAR、DNA Alkylating、EGFR 等。
EN3200	犬尿酸通路化合物库	12300+	作用于酪氨酸代谢通路的新的潜在活性化合物集合,可以作为早期药物开发的便捷且具有质量保证的起点。酪氨酸代谢通路的紊乱与恶性肿瘤密切相关。
EN3400	脂氧合酶靶向化合物库	1300+	脂氧合酶催化多不饱和脂肪酸生成相应的过氧化物,广泛表达于免疫、上皮和肿瘤细胞中,激活这些酶会引起许多结构和代谢变化。异常的 LOX 活性与肿瘤发生相关。
LF3000	谷氨酸受体靶向化合物库	4600+	代谢型谷氨酸受体是一类包含八种 G 蛋白偶联受体 (GPCR) 的家族,对于调节谷氨酸的作用和反应具有吸引力,与肿瘤的发生发展相关,是药物发现的目标之一。

代谢与肿瘤相关化合物

编号	名称	产品介绍
T0189	Pemetrexed	Pemetrexed acid 是一种鸟嘌呤衍生的抗肿瘤药物,可结合并抑制胸苷酸合酶、二氢叶酸还原酶和甘氨酸酰胺核苷酸甲酰转移酶。
T1038	Fludarabine	Fludarabine 是一种氟化嘌呤类似物,一种核酸合成抑制剂和 STAT1 激活抑制剂,具有抗肿瘤活性,可以用于治疗白血病和淋巴瘤。
T0010	6-Mercaptopurine	6-Mercaptopurine 是一种具有免疫抑制特性的抗代谢物抗肿瘤剂,通过抑制嘌呤代谢来干扰核酸合成,通常与其他药物联合用于白血病的治疗。
T1485	Methotrexate	Methotrexate 是一种叶酸类似物,一种二氢叶酸还原酶 DHFR 的抑制剂,具有抗代谢、抗肿瘤和免疫抑制等活性。
T2346	Enasidenib	Enasidenib 是口服具有活力的、可逆的、选择性 IDH2 突变酶抑制剂,抑制 IDH2R140Q 和 IDH2R172K。
T3617	Ivosidenib	Ivosidenib 是一种口服具有活力的异柠檬酸脱氢酶 1 的突变体酶 (mIDH1) 抑制剂,具有良好的安全性和临床活性,具有研究 AML 的潜力。
T6157	Devimistat	Devimistat 是一种线粒体代谢抑制剂,还是一种 lipoic acid 拮抗剂,能阻断线粒体能量代谢,诱导多种癌细胞凋亡。
T8532	IM156	IM156 是衍生自二甲双胍的化合物,是一种有效的氧化磷酸化 (OXPHOS) 抑制剂,可用于实体肿瘤的研究。
T5337	IACS-010759	IACS-010759 是一种口服有效的线粒体氧化磷酸化复合物 I 抑制剂,有研究复发/难治性 AML 和实体瘤潜力。
T6797	Telaglenastat	Telaglenastat 是一种选择性可逆的,有口服活性的谷氨酰胺酶 1 (GLS1) 抑制剂,可诱导细胞自噬,具有抗肿瘤活性。
T11412	IPN60090	IPN60090 是一种新型、强效、口服生物利用度高的肾型谷氨酰胺酶 (GLS1) 特异性抑制剂,具有潜在的抗癌和免疫刺激/免疫调节活性。
T6543	Indoximod	Indoximod 是一种具有口服具有活力的吲哚胺2,3-双加氧酶 (IDO) 途径抑制剂,是一种可用于癌症研究的免疫代谢佐剂。
T0676	Hydroxyurea	Hydroxyurea 是一种抗肿瘤剂,通过抑制核糖核苷二磷酸还原酶来抑制 DNA 合成。
T62560	Sirpiglenastat	Sirpiglenastat 是一种谷氨酰胺 (glutamine) 拮抗剂,是 DON 的前药,具有抗肿瘤活性。
T3210	AZD3965	AZD3965 是单羧酸转运蛋白 1 (MCT1) 的选择性抑制剂,Ki 值为1.6 nM,具有抗肿瘤活性。
T15271	Denifanstat	Denifanstat 是一种口服具有活性的选择性 FASN 抑制剂,有助于脂肪肝和癌症的研究潜力。
T9050	AG-270	AG-270 是一种可逆的、非竞争性的、具有口服活性的 MAT2A 变构抑制剂,具有抗肿瘤活性。
T20700	Racemetirosine	Racemetirosine 是一种酪氨酸 3-单加氧酶抑制剂,因此会抑制儿茶酚胺的合成,可以用于治疗胰腺癌。
T3548	Epacadostat	Epacadostat 是选择性的 IDO1 抑制剂,IC50=71.8 nM,具有抗肿瘤活性。
T1159	Leflunomide	Leflunomide 是嘧啶合成抑制剂,能够抑制二氢乳清酸脱氢酶,具有抗风湿的活性和潜在抗肿瘤活性。

4、EGFR 与肿瘤

EGFR(表皮生长因子受体)是肿瘤发生的重要驱动因素,肿瘤中 EGFR 的不适当激活主要由基因组中 EGFR 基因座的扩增和点突变引起,进而激活下游信号通路,引起肿瘤的过度生长。因此靶向 EGFR 及其下游信号级联被认为是癌症治疗中一种有价值的方法。近年来,已有几种靶向 EGFR 的酪氨酸激酶抑制剂(TKIs)和抗体药物(mAbs)上市。然而,鉴于对现有抑制剂的耐药性问题,研究仍在进行中,以寻找更有效的 EGFR 抑制剂。



EGFR 信号转导通路模型^[6]

➤ EGFR 与肿瘤相关化合物库

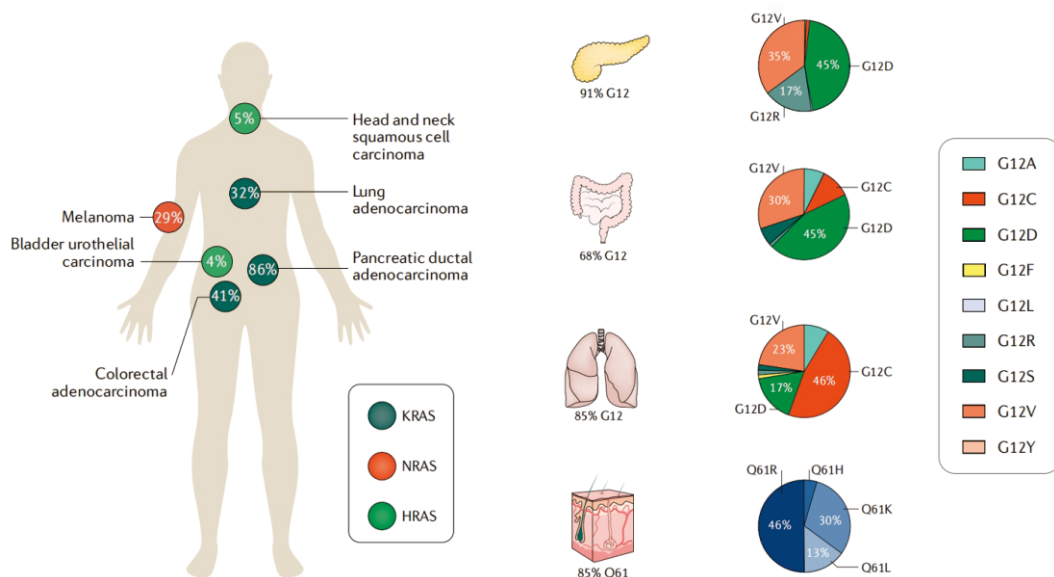
编号	名称	名称	产品介绍
L1600	激酶抑制剂库	2700+	激酶抑制剂/调节剂的独特集合,可用于高通量筛选和高内涵筛选;主要激酶靶点包括: EGFR、CDK、PI 3K、VEGFR、JAK、FGFR 等。
L1300	PI3K/Akt/mTOR 化合物库	400+	PI3K/Akt/mTOR 相关的生物活性小分子化合物的特有集合,靶点含 Akt、AMPK、mTOR、PI3K、ATR/ATM 等。
L1400	MAPK 抑制剂库	300+	MAPK信号通路相关的生物活性小分子化合物的特有集合;靶点含 ERK、JNK、MEK、p38、MAPK、Raf 等。
OT4900	表皮生长因子受体 (EGFR) 激酶抑制剂库	300+	EGFR 靶点相关的化合物的集合,可用于高通量和高内涵筛选;是抗肿瘤药物筛选的有效工具。

➤ EGFR 与肿瘤相关化合物

编号	名称	产品介绍
T1181	Gefitinib	Gefitinib 是一种 EGFR 一代抑制剂, 具有口服活性, 抑制 EGFR 19 Del 和 L858R 突变, 具有抗肿瘤活性。
T0373	Erlotinib	Erlotinib 是一种 EGFR 一代抑制剂, 可降低完整肿瘤细胞的 EGFR 自磷酸化, 用于治疗非小细胞肺癌。
T6153	Icotinib	Icotinib 是一种口服的 EGFR 一代抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 可用于治疗晚期非小细胞肺癌。
T21312	Afatinib	Afatinib 是一种不可逆的 EGFR 二代抑制剂, 抑制 EGFRwt、EGFR L858R、EGFR L858R/T790M 和 HER2。
T2483	Dacomitinib	Dacomitinib 是一种不可逆的特异性 EGFR 二代抑制剂, 作用于 EGFR、ERBB2 和 ERBB4。
T2490	Osimertinib	Osimertinib 是一种 EGFR 三代抑制剂, 抑制二代 EGFR 抑制剂产生的 T790M 耐药突变, 具有抗肿瘤活性。
T2325	Neratinib	Neratinib 是一种口服的、不可逆的酪氨酸激酶抑制剂, 抑制 HER2 和 EGFR, 具有抗肿瘤活性。
T12594	Pyrotinib dimaleate	Pyrotinib dimaleate 是选择性的 EGFR/HER2 双重抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 常用于乳腺癌研究。
T9927	Panitumumab	Panitumumab 是一种重组全人源 IgG2 单克隆抗体, 可与 EGFR 结合, 具有抗肿瘤活性。
T5462	Almonertinib	Almonertinib 是一种 EGFR 三代抑制剂, 对 T790M、T790M/L858R 和 T790M/Del19 表现出较强的抑制活性, 具有抗肿瘤活性。
T22254	Alflutinib	Alflutinib 是一种 EGFR 三代抑制剂, 它对 T790M 的耐药突变以及 EGFR 活性突变具有抑制作用, 对于肿瘤具有研究潜力。
T6918	Olmotinib	Olmotinib 是一种可口服的不可逆的 EGFR 三代抑制剂, 其与激酶结构域附近的半胱氨酸残基结合, 可用于非小细胞肺癌的研究。
T11161	EGFR-IN-7	EGFR-IN-7 (TQB3804) 是一种有效选择性的 EGFR 四代抑制剂, 抑制 EGFR WT 和 EGFR、C797S/T790M/L858R, 具有抗肿瘤活性。
T9754	BLU-945	BLU-945 是一种强效的、高选择性的、口服有效的、可逆的 EGFR 四代抑制剂, 可有效抑制具有 L858R 和/或外显子 19 缺失突变、T790M 突变和 C797S 突变的 EGFR。
T6824	EAI045	EAI045 是 EGFR 的四代抑制剂, 可有效抑制携带激活的 L858R 或外显子 19 缺失突变以及获得性 T790M 和 C797S 突变的三重突变 EGFR。
T8872	(Rac)-JBJ-04-125-02	(Rac)-JBJ-04-125-02 是选择性突变、可口服、变构的 EGFR 四代抑制剂, 在体外和体内对 EGFR L858R/T790M/C797S 突变均有效。
T10534	BI-4020	BI-4020 是一种口服有效、非共价的 EGFR 四代抑制剂, 能有效抑制 T790M 和/或 C797S 突变, 具有高激酶组选择性和良好的 DMPK 性质。
T0078	Lapatinib	Lapatinib 是一种口服的 ErbB2 和 EGFR 的抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 可以用于治疗 HER2 过表达的晚期或转移性乳腺癌。
T9905	Cetuximab	Cetuximab 属于单克隆抗体, 是一种 EGFR 的抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 可以抑制肿瘤细胞增殖, 诱导细胞凋亡。
T76890	Petosemtamab	Petosemtamab 是一种高效的抗 EGFR 和抗 LGR5 的单克隆抗体, 促使 LGR5+ 癌细胞中的 EGFR 信号传导中断和受体分解。

5、RAS 与肿瘤

RAS (包括 KRAS、NRAS 和 HRAS) 是肿瘤中最常见的突变基因家族之一,约 1/3 的人类癌症中会发生 RAS 基因突变,因此 RAS 被称为原癌基因。RAS 是一个小开关,用于发出 GTP 信号,在 GTP 绑定的活动状态和 GDP 绑定的非活动状态之间进行切换。RAS 的突变破坏了鸟嘌呤交换周期,通常通过变得不依赖 GAP 并将 RAS “锁定”在活性的 GTP 结合状态,从而激活下游信号通路,导致肿瘤细胞的生长。随着 KRAS G12C 共价抑制剂的成功研发,针对 RAS 靶点的药物研发正处于如火如荼的阶段。

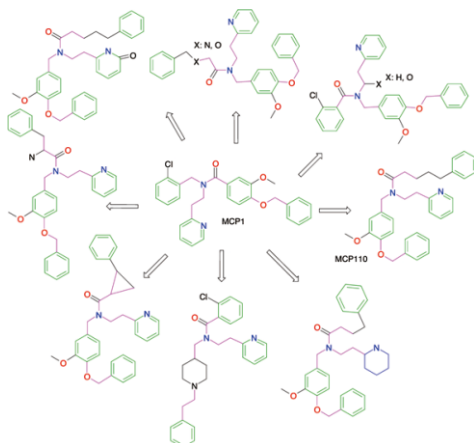


人类肿瘤中 RAS 突变的频率和分布^[7]

➤ KRAS 靶向化合物库 —— DP3800

KRAS 靶向类药化合物库包含 11,000+ 种化合物,是基于以下策略进行虚拟筛选得到的:采用评估药物相似性和化学活性的标准“MedChem”过滤器,利用 Tanimoto 度量,与已知 K/HRas 配体进行二维结构相似性分析,随后进行修饰分子结构同时保留其核心性质的等位变形程序,识别和利用已知具有生物活性的特权结构或碎片,最终得到 KRAS 靶向库。

TargetMol KRAS 靶向化合物库是高通量筛选的有力工具,助力您进行 RAS 的靶点研究和药物研发。



➤ RAS 与肿瘤相关化合物

编号	名称	产品介绍
T72062	BI-2865	BI-2865 是一种非共价的泛-KRAS 抑制剂, 可与 KRAS WT、G12C、G12D、G12V 和 G13D 突变体结合, 对肿瘤细胞显示出抗增殖活性。
T8684	Sotorasib	Sotorasib 是一种 KRAS G12C 共价抑制剂, 具有口服活性和选择性, 对 KRAS G12C 突变肿瘤具有抑制活性。
T8369	Adagrasib	Adagrasib 是一种 KRAS G12C 共价抑制剂, 具有口服活性和选择性, 对 KRAS G12C 突变肿瘤具有抑制活性。
T7414	ARS-853	ARS-853 是一种选择性共价 KRAS G12C 抑制剂, 通过与 GDP 结合的癌蛋白结合并阻止激活来抑制突变 KRAS 驱动的信号传导。
T40292	Opnurasib	Opnurasib 是一种可口服且具有选择性和有效性的共价 KRAS G12C 抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 可用于研究晚期非小细胞肺癌。
T36256	LC-2	LC-2 是一种与 MRTX849 共价结合 KRAS G12C 并招募 E3 连接酶 VH 的 PROTAC, 诱导 KRAS G12C 快速持续降解。
T9303	MRTX1133	MRTX1133 是一种 KRAS G12D 抑制剂, 具有强效性、选择性和非共价性, 对 KRAS G12D 突变的肿瘤具有抑制活性。
TP2358	KRPEP-2D acetate	KRPEP-2D acetate 被鉴定为针对 K-Ras G12D 突变体的选择性抑制肽, K-Ras 是有吸引力的癌症治疗靶点。
T74698	RMC-6236	RMC-6236 是一种 RAS (ON) 多选择性抑制剂, 对 KRAS 突变癌细胞系 HPAC 和 Capan-2 有抑制活性, 可用于癌症治疗。
T81263	RMC-7977	RMC-7977 是一种可逆的三重复合 RAS 抑制剂, 对 KRAS、NRAS 和 HRAS 的突变型及野生型变体表现出广谱活性。
T12979	BI-3406	BI-3406 是一种可口服、高效且选择性的 KRAS-SOS1 抑制剂, 抑制 KRAS 与 SOS1 之间相互作用, 具有抗癌活性。
T13176	TNO155	TNO155 是具有口服活性野生型 SHP2 的选择性变构抑制剂, 有研究 RTK 依赖性恶性肿瘤 (尤其是晚期实体瘤) 的潜力。
T38170	RMC-0331	RMC-0331 是一种可口服且具有高效性的 SOS1 抑制剂, 具有潜在的抗癌活性, 通过破坏 RAS-SOS1 相互作用阻断 RAS 激活。
T3564	SHP099	SHP099 是一种选择性的、有效的、有口服活性的 SHP2 抑制剂, IC ₅₀ =70 nM。
T7609	ARS-1620	ARS-1620 是 K-RAS G12C 的共价抑制剂, 具有理想的药代动力学。
T9972	Divarasib	Divarasib 是一种口服的、高效力和选择性的 KRAS G12C 抑制剂, 正在被研究用于实体肿瘤。
T39658	RMC-4630	RMC-4630 是一种有效的、敏感的、口服 SHP2 的抑制剂, 具有抗肿瘤活性。
T16762	RMC-4550	RMC-4550 是有效的、选择性的 SHP2 的变构抑制剂, 其 IC ₅₀ =0.583 nM。
T5418	BAY-293	BAY-293 是化学探针, 是一种有效的细胞活性 SOS1 抑制剂, 可破坏 KRAS-SOS1 相互作用。
T9755	MRTX0902	MRTX0902 是一种有效且高选择性的 SOS1 抑制剂, IC ₅₀ 为 46 nM, K _i 为 2 nM。

PRODUCTS

更多肿瘤相关产品

More Tumor Related Products

除了上述提及的肿瘤热门研究方向以外, TargetMol 还可以提供包括化合物、化合物库、试剂盒、技术服务等在内的其他各类肿瘤研究相关的产品及服务, 充分满足您的实验需求, 帮助您在肿瘤研究中取得更多进展。

小分子化合物产品

✓ 20+ 信号通路

✓ 靶点广泛

✓ 质量保障

编号	名称	产品介绍
T1564	Cisplatin	Cisplatin是一种DNA交联剂, 具有抗肿瘤活性, 能够通过形成DNA加合物来抑制DNA合成。
T0251	Gemcitabine	Gemcitabine是一种人工合成的胞嘧啶核苷衍生物, 一种DNA合成抑制剂, 具有抗肿瘤活性和抗代谢活性。
T1339	5-Azacytidine	5-Azacytidine是一种胞苷核苷类似物, 一种DNA甲基化抑制剂, 可以诱导细胞自噬, 具有抗肿瘤活性。
T0093L	Sorafenib	Sorafenib是一种多激酶抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 可以诱导细胞自噬和凋亡, 也可以激动铁死亡。
T1792	Regorafenib	Regorafenib是一种多靶点受体酪氨酸激酶抑制剂, 具有抗肿瘤和抗血管生成活性。
T6230	Imatinib	Imatinib是一种多靶点受体酪氨酸激酶抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 可用于治疗慢性粒细胞白血病。
T1829	Ruxolitinib	Ruxolitinib是一种JAK1/2抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 可以诱导细胞自噬和凋亡。
T1785	Palbociclib	Palbociclib是一种CDK抑制剂, 抑制CDK4和CDK6, 具有抗肿瘤活性, 有用于乳腺癌的研究潜力。
T1448	Dasatinib	Dasatinib是一种酪氨酸激酶抑制剂, 抑制Src和Bcr-Abl, 具有抗肿瘤活性, 用于治疗白血病和淋巴瘤等。
T2382	Vemurafenib	Vemurafenib是一种B-RAF抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 用于BRAF V600E突变阳性的黑色素瘤治疗。
T2125	Trametinib	Trametinib是一种MEK抑制剂, 抑制MEK1和MEK2, 可以激活自噬, 诱导凋亡, 具有抗肿瘤活性。
T1583	Vorinostat	Vorinostat是一种泛的HDAC抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 可以诱导细胞分化, 阻滞细胞周期, 诱导细胞凋亡。
T1952	MK-2206 dihydrochloride	MK-2206 dihydrochloride是一种变构Akt抑制剂, 抑制Akt1、Akt2和Akt3, 具有抗肿瘤活性。
T1178	Temozolomide	Temozolomide是一种DNA烷基化剂, 具有血脑屏障渗透性和口服活性, 具有抗肿瘤活性和抗血管生成活性。
T0984	5-Fluorouracil	5-Fluorouracil是一种尿嘧啶类似物, 一种DNA合成抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 通过抑制胸苷酸合成酶影响嘧啶的合成。
T1977	Dorsomorphin	Dorsomorphin是一种AMPK抑制剂, 可以抑制BMP I型受体ALK2、ALK3和ALK6, 可诱导自噬, 具有抗肿瘤活性。
T2381	Abemaciclib	Abemaciclib是一种选择性和特异性CDK4/6的双重抑制剂, 具有抗肿瘤活性, 被用于治疗晚期或转移性乳腺癌。
T1784	Everolimus	Everolimus是一种口服活性的mTOR1选择性抑制剂, 可以抑制肿瘤细胞增殖, 具有免疫抑制和抗肿瘤活性。
T2101	Navitoclax	Navitoclax是一种Bcl-2抑制剂, 可与Bcl-xL、Bcl-2、Bcl-w等蛋白结合, 具有抗肿瘤活性, 可以诱导细胞凋亡。
T2383	Panobinostat	Panobinostat是一种广谱的HDAC抑制剂, 有口服活性和非选择性, 具有抗肿瘤活性, 可以诱导细胞凋亡和自噬。

天然产物

✓ 来源广泛 ✓ 结构多样 ✓ 信息全面

编号	名称	产品介绍
T0968	Paclitaxel	Paclitaxel 是一种微管聚合物稳定剂,具有抗肿瘤活性,通过诱导有丝分裂停滞、细胞凋亡、细胞自噬等,导致细胞死亡。
T1034	Docetaxel	Docetaxel 是紫杉醇的半合成类似物,是一种微管解聚抑制剂,可以减弱 bcl-2 和 bcl-xL 基因表达的影响,具有诱导凋亡、抗肿瘤活性。
T1020	Doxorubicin hydrochloride	Doxorubicin hydrochloride属于蒽环类抗生素,是人类 DNA 拓扑异构酶 I/II 抑制剂,具有细胞毒性和抗肿瘤活性。
T0132	Etoposide	Etoposide是一种拓扑异构酶 II 的抑制剂,通过与拓扑异构酶 II 和 DNA 形成复合物来抑制 DNA 合成,具有抗肿瘤活性,可以诱导细胞凋亡、自噬。
T1123	Camptothecin	Camptothecin 属于生物碱类天然产物,是一种 DNA 拓扑异构酶 I (Topo I) 的抑制剂,具有抗肿瘤活性,可以诱导细胞凋亡。
T6228	Berberine	Berberine 属于生物碱类天然产物,可以激活 AMPK、抑制 DNA 拓扑异构酶、诱导 ROS 生成,具有抗肿瘤、抗菌、降血糖等生物学活性。
T4S0797	Bleomycin Sulfate	Bleomycin Sulfate 是一种糖肽抗生素,一种 DNA 合成抑制剂,具有抗肿瘤活性。
T6116	Brefeldin A	Brefeldin A 属于大环内酯类抗生素,是一种 ATPase 抑制剂,可以诱导肿瘤细胞分化和凋亡,也具有抑制自噬的活性。
T6062	Curcumin	Curcumin 属于酚类天然产物,是一种组蛋白乙酰化转移酶 p300/CREB 的抑制剂,具有抗肿瘤、抗炎和抗氧化等多种药理活性。
T1516	Decitabine	Decitabine 是脱氧胞苷类似物,一种 DNA 甲基转移酶抑制剂,具有抗肿瘤活性和抗代谢活性,诱导细胞周期阻滞和凋亡。
T1508	Doxycycline	Doxycycline 属于四环素类抗生素,是一种广谱的金属蛋白酶 (MMP) 抑制剂,具有抗菌活性和抗肿瘤活性。
T1687	Retinoic acid	Retinoic acid 是维生素 A 的代谢产物,是一种视黄酸受体 RAR 的天然激动剂,可以诱导细胞分化、减少细胞增殖和抑制肿瘤发生。
T1051	Cytarabine	Cytarabine 是一种核苷类似物,一种 DNA 合成抑制剂,可以抑制 DNA 聚合酶,诱导细胞周期阻滞、细胞自噬和凋亡,具有抗肿瘤活性。
T1272	Shikonin	Shikonin 属于天然产物,是一种 TMEM16A 氯离子通道抑制剂和选择性 PKM2 抑制剂,具有抗肿瘤、抗炎和伤口愈合活性。
T1125	Kaempferol	Kaempferol 属于天然类黄酮,是一种 ERR α 和 ERR γ 的反向激动剂,具有抗肿瘤、抗炎、抗氧化、抗菌和抗病毒等多种活性。
T2177	Triptolide	Triptolide 属于三环二萜类天然产物,是一种 NF- κ B 活化的抑制剂,具有免疫抑制、抗风湿、抗炎、抗增殖和抗肿瘤活性。
T2179	Homoharringtonine	Homoharringtonine 属于生物碱类天然产物,作用于肿瘤细胞的核糖体,可以抑制蛋白质的翻译,具有细胞毒性和抗肿瘤活性。
T3380	Tannic acid	Tannic acid 属于多酚类天然产物,是一种 hERG 通道阻塞剂,具有抗菌、抗氧化、抗炎和抗肿瘤等多种生物活性。
T0801	Rutin	Rutin 属于黄酮类天然产物,具有广泛的生物活性,包括抗氧化、抗炎、抗肿瘤、降血糖、神经保护、抗菌、抗衰老等等。
T0795	Irinotecan	Irinotecan 是喜树碱的衍生物,是一种 DNA 拓扑异构酶 I (Topo I) 的抑制剂,具有抗肿瘤活性。

抗体抑制剂

✓ 种类丰富

✓ 体内活性

✓ 低内毒素

编号	名称	产品介绍
T76796	Patritumab	Patritumab 是抗 HER3 单克隆抗体,具有潜在的抗肿瘤活性,促使细胞凋亡,抑制非小细胞肺癌的增殖。
T9912	Trastuzumab	Trastuzumab 属于人源化单克隆抗体,可以高亲和力与 HER2 选择性结合,具有抗肿瘤活性,可用于治疗 HER2 阳性肿瘤。
T9909	Pertuzumab	Pertuzumab 属于人源化单克隆抗体,是 HER2 二聚化抑制剂,可用于转移性 HER2 阳性乳腺癌的研究。
T76877	Vofatamab	Vofatamab 是一种全人源靶向 FGFR3 的单克隆抗体,具有潜在的抗癌抗肿瘤活性,常与其他化合物联用来治疗癌症。
T76673	Bemarituzumab	Bemarituzumab 是一种新型人源化IgG1单抗,靶向xGFR2b,可防止FGFR2b与 FGF的结合并活化,在癌症研究中的潜在应用。
T76780	Onartuzumab	Onartuzumab 是一种人源化抗酪氨酸激酶 c-MET 单价单克隆抗体,具有抗肿瘤活性,对 HGF 结合、受体磷酸化和信号转导有抑制作用。
T76743	Emibetuzumab	Emibetuzumab 是一种有效的人源化二价 MET 抗体 (IgG4 型),具有抗肿瘤活性,对 HGF 依赖性和非依赖性 MET 通路的激活和肿瘤生长有抑制作用。
T9904	Bevacizumab	Bevacizumab 是一种人源化单克隆抗体,能以高亲和力与所有 VEGF-A 异构体特异性结合,具有抗肿瘤活性。
T76794	Ulocuplumab	Ulocuplumab 是一种完全人源化抗 CXCR4 的 IgG4 抗体,在急性髓系白血病、非霍奇金淋巴瘤和多发骨髓瘤移植模型中展现出抗肿瘤活性。
T76873	Nidanilimab	Nidanilimab 是一种完全人源化的 IL1RAP 单克隆抗体,具有抗肿瘤活性,切断 IL1 α 和 IL1 β 信号通路,并诱导免疫系统破坏肿瘤细胞。
T76978	Siltuximab	Siltuximab 是一种靶向 IL-6 且具有抗肿瘤活性的单克隆抗体,可用于研究巨大淋巴结增生症 (MCD) 和 COVID-19。
T77093	Theralizumab	Theralizumab 是一种抗靶向 CD28 的单克隆抗体,可直接刺激 T 细胞,具有抗肿瘤活性,用于治疗 B 细胞慢性淋巴细胞白血病和类风湿性关节炎。
T9910	Rituximab	Rituximab 是抗 CD20 嵌合单克隆抗体,用于研究某些自身免疫疾病和肿瘤。
T9924	Obinutuzumab	Obinutuzumab 是一种新型糖工程化 II 型 CD20 单克隆抗体,用于研究非霍奇金淋巴瘤。
T76706	Varlilumab	Varlilumab 是一种新型的人 IgG1 抗 CD27 单克隆抗体,具有抗肿瘤活性,可用于研究晚期实体肿瘤。
T9918	Daratumumab	Daratumumab 是一种特异性抗 CD38 单克隆抗体,损伤 MM 细胞的粘附,具有抗多发性骨髓瘤的作用。
T35390	Magrolimab	Magrolimab 是一种人源化抗 CD47 IgG4 单克隆抗体,通过阻断CD47来展现其抗肿瘤活性,可用于和其他化合物联合治疗复发性骨髓瘤。
T9919	Alemtuzumab	Alemtuzumab 是人源化抗 CD52 单克隆抗体,能够特异性作用于 CD52 抗原,诱导淋巴细胞深度耗竭,可用于治疗 B 淋巴细胞白血病。
T77367	Urelumab	Urelumab 是一种人源化的 IgG4 单克隆抗体,经常被当作 CD137 激动剂使用,具有潜在的抗肿瘤活性。
T76691	Monalizumab	Monalizumab 是一种人源化抗 NKG2A 的单克隆抗体,激活自然杀伤细胞功能,具有抗肿瘤活性,可用于研究颈部鳞状细胞癌。

重组蛋白

✓ 种属、标签、表达系统选择丰富

✓ 高纯度、低内毒素

✓ 严格活性验证

编号	名称	产品介绍
TMPY-00897	PD-1 Protein, Human, Recombinant (His)	PD-1 是一种I型跨膜糖蛋白,是属于 CD28/CTLA-4 家族的免疫受体,在与两个配体 PD-L1 或 PD-L2 相互作用时,通过募集蛋白酪氨酸磷酸酶 SHP-2 来负调控抗原受体信号传导。
TMPY-05208	PD-L1 Protein, Human, Recombinant	PD-L1 是 PD1 的配体,通过增加抗原特异性 T 细胞的凋亡而导致免疫原性肿瘤生长的生长,并可能有助于癌症的免疫逃避。
TMPY-04824	CTLA-4 Protein, Human, Recombinant	CTLA4 是一种单程 I 型膜蛋白,是免疫球蛋白超家族的成员,是参与 T 细胞活化负调控的必需受体,向 T 细胞传递抑制信号。
TMPY-01621	TIM-3/KIM-3/HAVERCR2 Protein, Human, Recombinant (His)	TIM-3 是一种跨膜糖蛋白,在终末分化的 Th1 细胞表面表达。sTim-3 显著损害了 T 细胞的抗肿瘤免疫,表现为抗肿瘤 CTL 活性降低和肿瘤中肿瘤浸润淋巴细胞数量减少。
TMPY-00742	EGFR Protein, Human, Recombinant (His)	EGFR 蛋白是 I 型跨膜糖蛋白,在调节细胞增殖、存活和分化的信号通路中起着至关重要的作用,EGFR信号传导也已被证明对肿瘤发生和疾病进展具有作用。
TMPY-00167	HER2/ERBB2 Protein, Human, Recombinant	HER2 是一种 I 型膜糖蛋白,属于 EGFR 家族,在发育、细胞增殖和分化中起着关键作用,与乳腺癌、前列腺癌、卵巢癌、肺癌等多种癌症的恶性程度和预后不良有关。
TMPJ-00412	VEGFR1/FLT-1 Protein, Human, Recombinant (hFc)	VEGFR1 是一种必需的受体酪氨酸激酶,在调节 VEGF 家族介导的血管生成、血管生成和淋巴管生成中发挥重要作用,可以促进 PGF 介导的内皮细胞增殖,某些类型癌症细胞的增殖。
TMPY-02361	VEGFR2/KDR Protein, Human, Recombinant (His)	VEGFR2 是血管生成和病理条件(如癌症和糖尿病视网膜病变)发展的主要信号转导子,主要在血管内皮细胞中表达,并且在肿瘤血管系统中表达上调。
TMPY-04396	C-ABL/ABL1 Protein, Human, Recombinant (GST)	c-Abl 是一种非受体酪氨酸激酶,参与连接细胞表面、细胞骨架和细胞核的多种信号通路,已成为人类慢性粒细胞白血病的重要治疗靶点。
TMPY-06056	KRAS Protein, Human, Recombinant (G12D, His)	K-Ras 属于小 GTP 酶超家族 Ras 家族,是许多信号转导途径的早期参与者。K-Ras 基因的突变也是许多癌症发展的重要步骤,在白血病、结肠癌、胰腺癌和肺癌中发现率很高。
TMPY-01168	ALK-1 Protein, Human, Recombinant (His)	ALK 是一种受体酪氨酸激酶,发生变异时被异常激活,而自身激酶活性的增强能激活下游信号分子,进而使细胞增殖失控,导致肿瘤的产生。
TMPY-01296	HGFR/c-Met Protein, Human, Recombinant (His)	HGFR 是一种受体酪氨酸激酶,正常的 HGF/HGFR 信号传导对胚胎发育、组织修复或伤口愈合至关重要,而异常活性的 HGFR 与肿瘤发生密切相关,特别是在侵袭和转移表型的发展中。
TMPY-01188	PARP Protein, Human, Recombinant (His)	PARP 参与了包括 DNA 修复、基因组稳定性等在内的一系列细胞过程。PARP1 抑制剂被用于重组缺陷型癌症(如 BRCA2 肿瘤)的靶向癌症治疗。
TMPY-02700	BCL2 Protein, Human, Recombinant (His)	BCL2 属于 Bcl-2 家族,调节并参与程序性细胞死亡或凋亡。BCL2 的组成性表达,例如 BCL2 易位到 Ig 重链位点,被认为是滤泡性淋巴瘤的病因。
TMPY-01400	CD4 Protein, Human, Recombinant (His)	T 细胞表面糖蛋白 CD4 是一种单程 I 型膜蛋白,在辅助 T 细胞、调节性 T 细胞、单核细胞、巨噬细胞和树突状细胞表面表达。
TMPY-01949	CD19 Protein, Human, Recombinant (His)	CD19 是 B 细胞的生物标志物,通过 B 细胞受体调节 B 细胞的发育增殖和分化并介导 T 细胞对靶细胞的杀伤。CD19 被广泛应用于白血病、淋巴瘤及免疫系统疾病的诊断和预后判断。
TMPY-05201	Siglec-2/CD22 Protein, Human, Recombinant	CD22 是凝集素的免疫球蛋白超家族 SIGLEC 家族的成员,在体外激活 B 细胞并调节抗原受体信号传导,主要参与骨髓、血液和淋巴组织边缘区内成熟 B 细胞的产生。
TMPY-03401	CD27/TNFRSF7 Protein, Human, Recombinant (His)	Cd27 是 TNF 受体超家族的一个成员,,在淋巴增殖、分化和凋亡中发挥作用,在 T 细胞免疫的产生中起着重要作用,是正常记忆 B 细胞的强大标志物。
TMPY-05319	BCMA/TNFRSF17 Protein, Human, Recombinant (His)	BCMA/TNFRSF17 是 TNF 受体超家族的成员,在成熟的 B 淋巴细胞中优先表达,对 B 细胞的发育和自身免疫反应很重要,是骨髓瘤患者对 DLI 有反应的供体 B 细胞免疫的靶点。
TMPY-01139	PDGFRA Protein, Human, Recombinant (His)	PDGFRA 是血小板衍生生长因子家族成员的细胞表面受体,参与肿瘤血管生成和肿瘤微环境的维持,并与肝细胞癌的发展和转移有关。

活性化合物库

✓ 活性良好 ✓ 靶点明确 ✓ 支持定制

编号	名称	数量	产品介绍
L1000	上市药物库	2800+	上市药物化合物集合, 所有化合物得到FDA、EMA、NMPA等权威部门审批; 老药新用、新药物靶点筛选的有效工具。
L4000	经典已知活性库	14500+	可用于高通量筛选、高内涵筛选、细胞诱导和靶点确认; 所有化合物都有相应的靶点信息的描述, 靶点信息已知; 是老药新用、细胞诱导靶点筛选的有效工具。
L4200	FDA上市药物库	1700+	全部得到FDA批准, 提供FDA批准编号, 用于药物重定位、新的药物靶点筛选的有效工具; 经过了严格的临床前研究和临床试验, 生物活性和安全性得到保障。
L6000	高通量筛选天然产物库	4300+	天然产物的独特集合, 是药物开发、药理研究、干细胞分化、指纹图谱研究、质量研究等领域的有力工具, 可用于HTS和HCS。
L2100	抗癌化合物库	7300+	产品经过临床验证, 具有生物安全保障和一定的生物活性; 是肿瘤发生机理研究、抗肿瘤药物筛选的有效工具。
L2110	抗癌上市药物库	1800+	所有化合物都经过了严格的临床前研究和临床试验, 由FDA、EMA或NMPA批准上市, 具有已知且良好的生物活性、安全性和生物利用度, 可用于高通量、高内涵筛选。
L2120	抗癌临床化合物库	2600+	生物活性已经临床前实验证实, 所有化合物均已进入临床实验阶段的抗癌化合物; 包括肺癌、乳腺癌、白血病、淋巴瘤等15种癌症, 是癌症相关研究的有效筛选工具。
L2160	抗癌活性化合物库	3200+	抗癌化合物库中筛选具有抗癌活性的化合物, 用于高通量、高内涵筛选; 肿瘤机理研究、抗肿瘤药物筛选的有效工具。
L2150	抗癌药物库	3100+	从抗癌活性库中筛选上市和临床期药物, 所有化合物都具有已知且良好的生物活性、安全性和生物利用度, 是进行癌症相关研究和药物重定位有效的筛选工具。
L2151	化疗药物库	50+	肿瘤化疗药物的集合; 包括烷化剂、抗代谢药、抗癌抗生素、植物类抗癌药、激素、免疫制剂等。
L2152	靶向治疗药物库	100+	肿瘤靶向治疗药物的集合, 可以用于高通量和高内涵筛选; 靶点包括EGFR、VEGFR、c-Met、Bcr-Abl、HER2等。
L2140	癌细胞分化化合物库	400+	诱导肿瘤细胞分化化合物的独特集合, 可用于高通量筛选和高内涵筛选; 提供产品的来源、化学信息和生物学信息, 为筛选提供理论方向和研究基础。
L2180	抗肿瘤库Plus	1400+	抗肿瘤相关、结构新颖的化合物; 99%以上化合物活性小于3 μ M, 具有较高抗肿瘤潜力; 靶向42种肿瘤相关靶点。
L2190	抗肺癌化合物库	1700+	与肺癌相关的化合物, 可以用于抗肺癌药物研发和药理研究; 靶点包含EGFR, PI3K, FGFR, HER2, ALK, c-Met等。
L2191	抗乳腺癌化合物库	1900+	可以用于抗乳腺癌药物研发和药理研究; 靶点包含HER-2, VEGF, EGFR, PARP, CDK4/6, HSP, PD-1, SET7/9, BRCA等。
L2192	抗胰腺癌化合物库	2200+	与胰腺癌相关的化合物; 靶点含KRas, MEK, ERK, RAF, PI3K, HER2, EGFR, JAK/STAT, IGF-1R, VEGF, TGF β 等。
L2193	抗肝癌化合物库	1700+	与肝癌相关的化合物, 可以用于抗肝癌药物研发和药理研究; 通路靶点包含PI3K/Akt/mTOR, EGFR, FGFR, Met等。
L6700	抗癌天然产物库	1800+	已知活性天然产物的独特集合, 是肿瘤药物开发、抗癌先导化合物筛选等领域的有力工具, 可用于HTS和HCS; 全部产品活性已知, 来源清晰, 信息全面, 性价比高。
L6740	抗结直肠癌中药单体化合物库	300+	抗结直肠癌相关的中药单体集合, 结构多样, 包含黄酮、皂苷、萜类、生物碱等类别; 靶向Wnt/beta-catenin、TGF-beta/Smad、NF- κ B、Notch等多种靶点。
L2200	酪氨酸激酶分子库	1000+	酪氨酸激酶抑制剂的独特集合; 靶点含c-kit、c-Met、EGFR、FGFR、SRC、JAK、SYK、Btk、Bcr-Abl等。

类药化合物库

✓ 多样性好 ✓ 类药性佳 ✓ 新颖性好

编号	名称	数量	产品介绍
L5600	Mini骨架库	5000+	多样性好, 从一百多万个小分子中挑选而出, 5000 个化合物代表 5000 种骨架结构; 类药性佳, 所有化合物均经药化性质筛选过滤, 剔除毒性、PAINS 等不利结构。
DD1100	抗肿瘤筛选化合物库	65000+	一组具有抗癌活性和广泛靶点空间的小分子化合物; 具有广泛的多样性和针对性, 由 3400 个独特的骨架和 946 个不同的杂环组成, 反映出分子结构的丰富多样性。
LF1600	抗癌筛选化合物库	13600+	分为两个子库: 通过 2D 相似性搜索的抗癌重点库 (9,100 种化合物) 和对接抗癌靶向库 (4,500 种化合物); 具有潜在的抗肿瘤活性, 针对不同类型的癌症。
LF5700	基质金属蛋白酶靶向化合物库LF	2000+	MMPs 是治疗癌症 (肿瘤血管生成和转移) 的有潜力靶点。根据结构和物理化学参数的严格选择, 设计了其潜在基质金属蛋白酶抑制剂的筛选库。
DD3500	核苷模拟物库	2600+	基于核苷结构, 精心设计合成多种核苷结构类似物, 经 REOS、MedChem 过滤器剔除不良结构, 得到核苷模拟物库; 是研究核苷类抗病毒、抗肿瘤药物的有力工具。
DO1200	药物靶点库	53200+	一库多用, 涵盖 300 多个靶点, 超过 500 个特定靶向化合物子库, 适用于多种筛选目的; 多样性好, 超过 1900 种化合物骨架, 600 多种特有杂环结构, 具有更高的筛选概率和新颖性。
DP5560	c-Met 靶向化合物库	16000+	c-MET 相关化合物的集合; c-MET 与肿瘤密切相关, 在大多数实体肿瘤的肿瘤活检中检测到 c-MET 和 HGF 的表达, 并且在多种人类恶性肿瘤中发现了 c-MET 信号通路的存在。
DP2900	PI3K 靶向化合物库	19000+	PI3K 抑制剂在抑制肿瘤进展方面是有效的。将参考化合物和库中的分子在 PI3K 活性位点的三维模型中进行对接, 代表性化合物与报道的 PI3K 抑制剂显示了类似的结合模式。
DP2580	Bcl2-PPI 抑制剂库	11000+	基于许多癌症依赖于抗凋亡 Bcl-2 蛋白质, 以及 Bcl-2 蛋白质通过定义的 BH 结构域相互作用的事实, 促使开发能模拟 BH3 结构域作用的药物, 具有用于肿瘤治疗的潜力。
L9920	DGK 抑制剂筛选库	12000+	DGK 与多种肿瘤的发生发展密切相关。使用 3D 药效团建模和子结构筛选/生物等排替换方式筛选具有成为 DGK 抑制剂潜力的类药化合物, 是 DGK 抑制剂筛选、靶点药物开发的有力工具。

试剂盒

✓ 灵敏度高 ✓ 稳定性好 ✓ 高分引用文献

编号	名称	产品介绍
C0005	Cell Counting Kit-8 (CCK-8)	Cell Counting Kit-8 (CCK-8) 是一种氧化还原反应的指示剂, 通过比色, 可以动态地量化活细胞的数量, 从而对细胞增殖或药物毒性进行检测。
C0045	RIPA 裂解液	RIPA 裂解液是一种传统的细胞组织快速裂解液, 裂解得到的蛋白样品可以用于常规的 PAGE、Western Blot、IP、co-IP 和 ELISA 等。
C0001	蛋白酶抑制剂 Cocktail	蛋白酶抑制剂 Cocktail 由 6 个成分组成, 适用于从多种组织细胞中提取蛋白质, 能够更有效的获得目的蛋白质。
C0004	磷酸酶抑制剂 Cocktail	磷酸酶抑制剂 Cocktail 是含有广谱磷酸酶抑制剂的混合物, 高效抑制蛋白提取物中的磷酸酶, 提供更全面的磷酸酶抑制能力。
C0048	去乙酰化酶抑制剂 Cocktail	去乙酰化酶抑制剂 Cocktail 由 4 个成分组成, 抑制 Class I/II/III HDAC, 可以有效抑制各类去乙酰化酶的活性, 维持蛋白乙酰化状态。
C0050	BCA蛋白浓度测定试剂盒	BCA 应用最广泛的蛋白浓度测定方法, 常用于蛋白提取后的定量检测, 具有操作简单、稳定性好、灵敏度高和兼容性高等优势。

技术服务

TargetMol 可以提供肿瘤新药发现初期的各类体外实验服务项目,包括计算机辅助药物设计、基于靶点的药物活性筛选、抗肿瘤药物体外筛选等,共 300 多种技术服务项目,旨在为全球药物研发用户提供优质且高效的科研技术支持。

➤ 计算机虚拟筛选

凭借十余年的计算药物研发经验, TargetMol 的筛选团队可以从千万级别的化合物数据库进行虚拟筛选,精选出针对特定肿瘤靶点的潜在活性化合物。这种筛选方法不仅成功率高,而且成本效益显著。

➤ 基于靶点的药物活性筛选

TargetMol 拥有丰富的酶学靶点筛选经验,已经开发建立 300 多种筛选模型,包括组蛋白去乙酰化酶、组蛋白去甲基化酶、酪氨酸激酶、丝氨酸激酶、甲基化转移酶、磷酸二酯酶、DNA 修复酶、热休克蛋白、以及免疫相关蛋白等。主要检测方法有 Fluorescence 荧光检测法, Absorbance 光吸收检测, Chemiluminescence 化学发光检测等。

➤ 抗肿瘤药物体外筛选

TargetMol 拥有超过 170 种经过 STR 鉴定的人源肿瘤细胞库,可以通过 CCK8、Cell Titer-Glo 等细胞增殖实验为客户提供化合物的初步筛选,帮助发现潜在的新型抗肿瘤化合物。

➤ 肿瘤研究相关服务项目

✓ 团队专业 ✓ 经验丰富 ✓ 项目报告详细

项目类别	项目介绍	项目内容
计算机辅助药物设计	虚拟筛选、分子对接、反向找靶、分子动力学模拟、超高通量虚拟筛选……	以分子结构的理论计算方法为基础,通过计算机模拟和计算来预测药物与靶点生物大分子之间的作用,预测给定的分子是否能与靶点结合及其结合强度,以此设计和优化药物分子。
实体化合物活性筛选	基于靶点筛选:酶学靶点活性检测、核受体靶点活性检测、GPCR靶点活性检测、分子结合&互作检测。 基于表型筛选:细胞增殖检测、细胞周期检测、细胞凋亡检测。 DNA编码化合物库筛选 药代动力学研究	化合物活性筛选是现代药物开发流程中检验和获取具有特定生理活性化合物的一个步骤,系指通过规范化的实验手段从大量化合物中选择对某一特定作用靶点或表型具有较高活性化合物的过程。
药物设计和结构优化	化合物定制合成 分子砌块 ……	凭借公司先进的计算机辅助药物设计基础,及研发团队多年的药物合成专业技术沉淀及经验积累,可为客户提供从分子设计,结构改造,到定制化化合物产出等一站式服务,加快客户的新药研发进程。

APPLICATION

应用案例

Application Cases



Datta J, et al. Combined MEK and STAT3 Inhibition Uncovers Stromal Plasticity by Enriching for Cancer-Associated Fibroblasts With Mesenchymal Stem Cell-Like Features to Overcome Immunotherapy Resistance in Pancreatic Cancer. *Gastroenterology*. 2022 Dec;163(6):1593-1612.

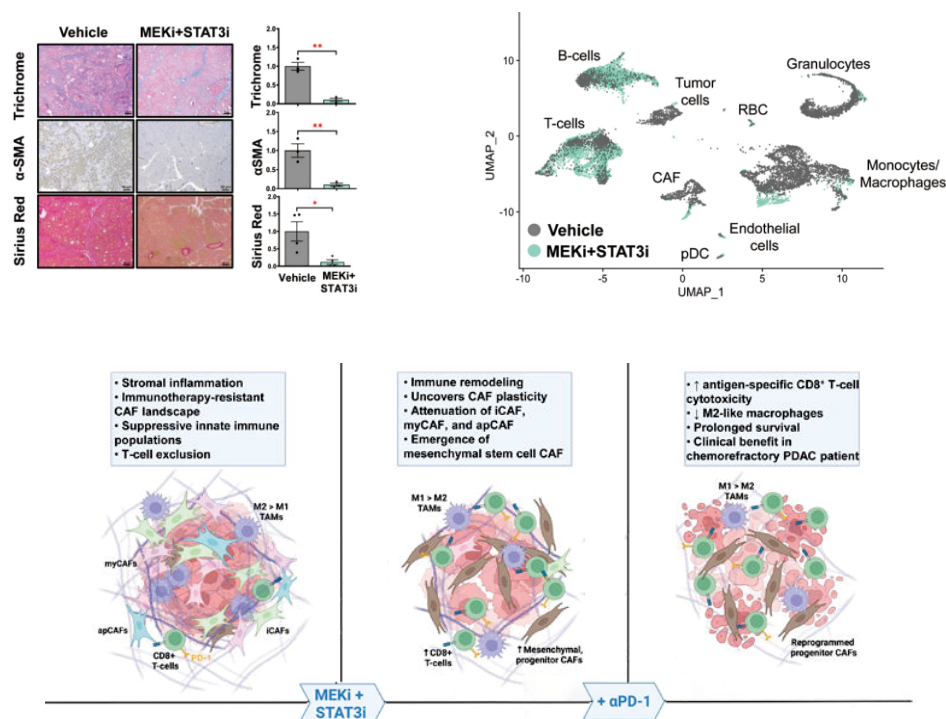
IF:29.4



(i.e., flow cytometry, CyTOF, histology), PKT mice were treated with vehicle (0.5% HPMC+0.1% Tween80), trametinib (MEKi, Novartis, 2.5 mg/kg, oral gavage three times weekly), **ruxolitinib (STAT3i, TargetMol, 15 mg/kg, oral gavage three times weekly)**, αPD-1 antibody (BioXCell, Clone #BE0273, 200 μg/mouse, intraperitoneal injection twice weekly), or combined MEKi+STAT3i or MEKi+STAT3i with αPD1 beginning at 4–4.5 weeks of age. Mice were sacrificed after four weeks of treatment or when moribund. For survival studies, MEKi (2.5 mg/kg) and STAT3i (15 mg/kg) were administered by oral gavage 5 days/week starting at 4.5 weeks of age; αPD-1 antibody dosing remained intraperitoneal injection

为了评估 MEKi 和 STAT3i 联合使用是否能重新编程癌症相关成纤维细胞 (CAF) 和免疫微环境, 以克服 PDAC 对免疫检查点抑制治疗的抵抗, 本研究通过单细胞 RNA 测序分析了 MEKi (trametinib) 和 **STAT3i (ruxolitinib)** 处理与对照媒介物处理的 PKT 肿瘤中的 CAF 和免疫细胞的转录组。通过比较用载体、抗 Pd1 单一疗法和 MEKi + STAT3i 联合抗 Pd1 处理的 PKT 小鼠的肿瘤生长、存活率和免疫分析来检测治疗效果。

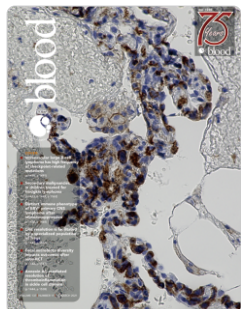
结果表明, 联合使用 MEKi 和 STAT3i 能有效减轻肿瘤微环境中的基质炎症, 并丰富具有间充质干细胞样特性的 CAF 表型, 以克服 PDAC 对现有免疫疗法的耐药性。





Xu Y, et al. Targeting the Otub1/c-Maf axis for the treatment of multiple myeloma. *Blood*. 2021 Mar 18;137(11):1478-1490.

IF:20.3

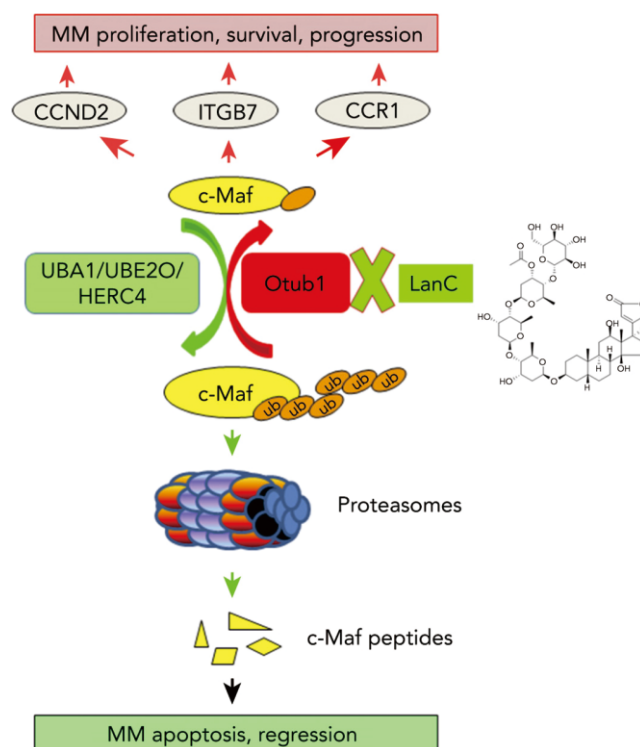
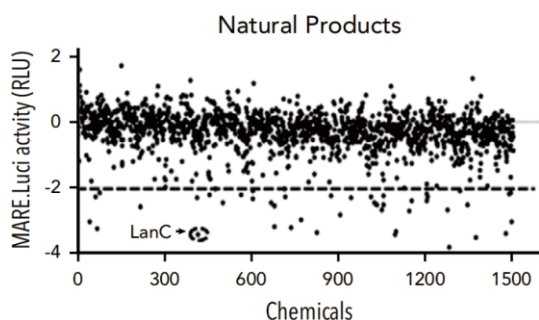
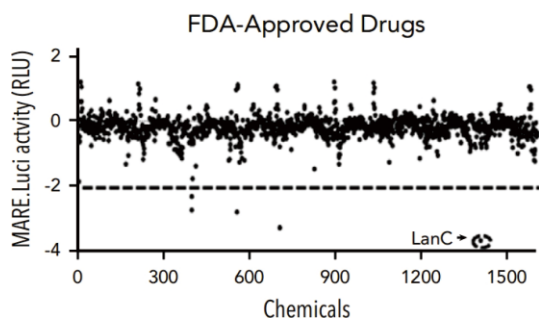


Chemicals, antibodies, and plasmids

CCND2 and antibodies (Ab) were provided by AddGene (Cambridge, MA). Lanatoside C (LanC), the US Food and Drug Administration (FDA)-approved drug library, and the Natural Products Library were obtained from Targetmol (Wellesley Hills, MA). The Maf plasmids were obtained as described previously.^{8,11}

致癌转录因子 c-Maf 被认为是多发性骨髓瘤 (MM) 的理想治疗靶点, 研究发现, Otub1/c-Maf 轴可能是 MM 的治疗靶点。为了探索这一可能性, 研究团队对 TargetMol 的 FDA 上市药物库和天然产物库进行了筛选, 采用基于 c-Maf 识别元件驱动的荧光素酶检测方法。发现通用强心苷 Lanatoside c (LanC) 能够阻止 c-Maf 去泛素化, 并通过破坏 Otub1 和 c-Maf 之间的相互作用诱导其降解。

本研究确定 Otub1 是一种新的 c-Maf 去泛素酶, 并确定 Otub1/c-Maf 轴是 MM 的潜在治疗靶点。



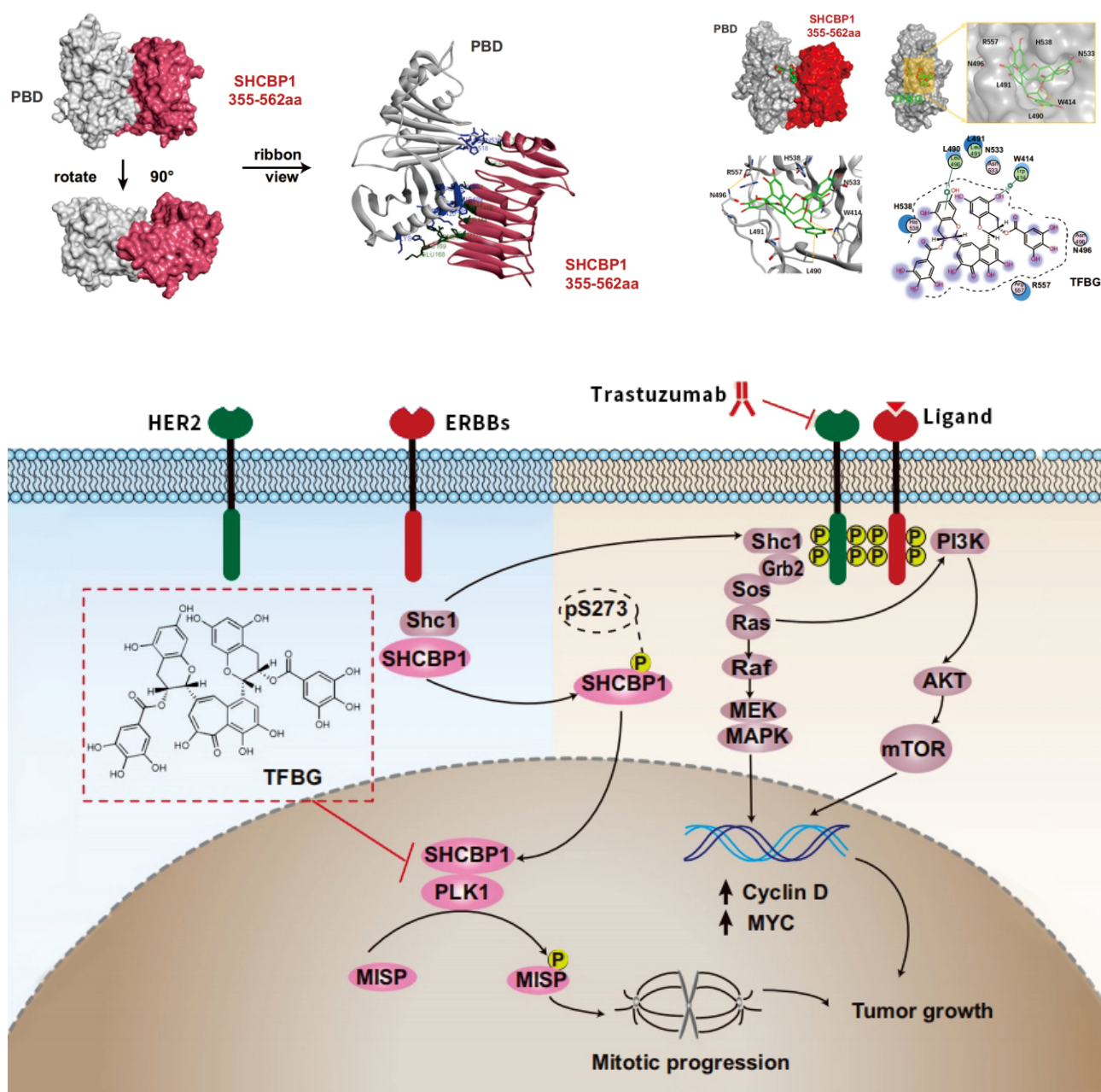


Shi W, et al. Hyperactivation of HER2-SHCBP1-PLK1 axis promotes tumor cell mitosis and impairs trastuzumab sensitivity to gastric cancer. Nat Commun. 2021 May 14;12(1):2812.

IF:16.6

客户研究发现 PLK1-SHCBP1 复合体参与细胞有丝分裂, 促进癌症的发生。因此, 开发针对 PLK1-SHCBP1 复合物的抑制剂具有抑制细胞分裂并防止癌症发展的潜力。

TargetMol CADD 团队 通过同源建模的方法构建 SHCBP1 的三维结构, 再通过分子对接预测了 PLK1-SHCBP1 的结合模式, 通过结合点突变分析和免疫共沉淀实验, 进一步确定了蛋白的互作机制。接下来利用虚拟筛选技术, 我们对 **TargetMol 的 17,676 个化合物 (主要包含天然产物及已知活性化合物)** 进行筛选。通过计算机模拟和人工复核, 筛选出 40 个候选化合物。其中, 选择性抑制剂 TFBG (TSID:T4S0554) 显示出良好的潜力, 有望成为胃癌治疗的有效方法。



CITATIONS
产品文献引用

Citations

1. Meng Y, et al. Temporospacial inhibition of Erk signaling is required for lymphatic valve formation. Signal Transduct Target Ther. 2023 Sep 11;8(1):342.

Trametinib

2. Hong JH, et al. Integrative multiomics enhancer activity profiling identifies therapeutic vulnerabilities in cholangiocarcinoma of different etiologies. Gut. 2023 Nov 24;gutjnl-2023-330483.

Everolimus

3. Zhu C, et al. CPSF6-mediated XBP1 3'UTR shortening attenuates cisplatin-induced ER stress and elevates chemo-resistance in lung adenocarcinoma. Drug Resist Updat. 2023 May;68:100933.

Cisplatin

4. Wang B, et al. An integrated microfluidics platform with high-throughput single-cell cloning array and concentration gradient generator for efficient cancer drug effect screening. Mil Med Res. 2022 Sep 22;9(1):51.

Imatinib, Cytarabine

5. Wang C, et al. ENO2-derived phosphoenolpyruvate functions as an endogenous inhibitor of HDAC1 and confers resistance to antiangiogenic therapy. Nat Metab. 2023 Oct;5(10):1765-1786.

Regorafenib, Sorafenib

6. Liang J, et al. Epigenetic suppression of PGC1 α (PPARGC1A) causes collateral sensitivity to HMGCR-inhibitors within BRAF-treatment resistant melanomas. Nat Commun. 2023 Jun 5;14(1):3251.

Anti-Cancer Metabolism Compound Library

7. Smer-Barreto V, et al. Discovery of senolytics using machine learning. Nat Commun. 2023 Jun 10;14(1):3445.

Anti-Cancer Compound Library

8. Qian L, et al. Targeting NRAS-Mutant Cancers with the Selective STK19 Kinase Inhibitor Chelidonine. Clin Cancer Res. 2020 Jul 1;26(13):3408-3419.

Natural Product Library

9. Yan Y, et al. A novel HIF-2 α targeted inhibitor suppresses hypoxia-induced breast cancer stemness via SOD2-mtROS-PDI/GPR78-UPRER axis. Cell Death Differ. 2022 Sep;29(9):1769-1789.

Diversity Discovery Library

10. Li M, et al. A low-molecular-weight compound exerts anticancer activity against breast and lung cancers by disrupting EGFR/Eps8 complex formation. J Exp Clin Cancer Res. 2019 May 22;38(1):211.

TOPSCIENCE Database

参考文献

【1】CA Cancer J Clin. 2024 Apr 4.

【2】Cancer Discov. 2022 Jan;12(1):31-46.

【3】Nat Rev Mol Cell Biol. 2021 Apr;22(4):266-282.

【4】Cell. 2021 Oct 14;184(21):5309-5337.

【5】Nat Rev Cancer. 2021 Oct;21(10):669-680.

【6】Nat Cancer. 2021 Apr;2(4):377-391.

【7】Nat Rev Drug Discov. 2020 Aug;19(8):533-552.

TargetMol Chemicals Inc.

抑制剂&激动剂 | 化合物库 | 天然产物 | 重组蛋白 | 技术服务

www.targetmol.cn

Tel: 400 - 820 - 0310

Email: sales@targetmol.cn

TargetMol® 所有产品和服务仅用于科学研究, 不能被用于人体, 我们不向个人提供产品和服务。



官方微信公众号



积分商城小程序