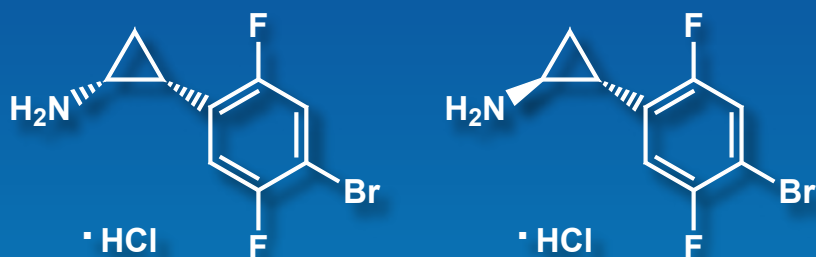


エピジェネティクス研究用の リシン特異的脱メチル化酵素 (LSD) 阻害剤



LSD Inhibitor S1024
25mg 18,000円
[B6490]

LSD Inhibitor S1025
25mg 10,000円
[B6491]

特長

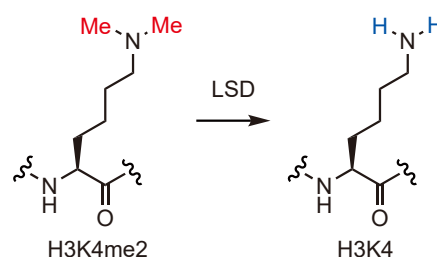
- LSD1に対してはB6490・B6491とも同程度に強力な阻害活性を示し、LSD2に対してはB6491よりもB6490の方が高い阻害活性を示します¹⁾。
- B6490はその阻害効果により、細胞内のヒストン修飾型H3K4me2を増加させます¹⁾。
- 未知の部分が多いLSD2の機能解明の研究に利用可能です²⁾。

リシン特異的脱メチル化酵素 (Lysine specific demethylase; LSD) は、フラビンアデニンジヌクレオチド (FAD) を補酵素としてヒストンH3におけるメチル化リシン残基 (H3K4) の脱メチル化を触媒し、エピジェネティクスに遺伝子の発現を調節しています²⁾。

LSDには2つのパラログがあり、LSD1は、がん細胞増殖に関与しているとされており、創薬標的として期待されています。LSD2は、未知の部分が多いため機能解明の研究が行われています。

表. LSD1とLSD2に対する阻害活性¹⁾

| | K_i (μM) | | selectivity |
|--------------|-------------------------|----------------|-------------|
| | LSD1 | LSD2 | |
| B6490 | 0.094 \pm 0.0057 | 8.4 \pm 0.43 | 89 |
| B6491 | 0.098 \pm 0.0071 | 180 \pm 17 | 1800 |



細胞内のDNAは、ヒストンタンパク質と共にクロマチン構造を形成しており、ヒストンタンパク質が種々の化学修飾を受けることで、遺伝子配列によらずに遺伝子の発現の調節が行われていることが解明されつつあります。エピジェネティクス領域として、がん治療や再生医療への応用が期待されています。

本製品は、梅原先生のご協力のもと阻害活性を確認しました。

引用文献 1) H. Niwa, T. Umehara *et al.*, *ACS Med. Chem. Lett.* **2022**, 13, 1485. <https://doi.org/10.1021/acsmchemlett.2c00294>
2) N. D. Das, H. Niwa, T. Umehara, *Epigenomes* **2023**, 7, 7. <https://doi.org/10.3390/epigenomes7010007>

関連製品

trans-2-Phenylcyclopropanamine Hydrochloride
N-(9-Cyclopropyl-1-oxononyl)-N-hydroxy- β -alanine

100mg 4,000円 [P2908]
5mg 19,200円 [C3134]

弊社では、取り扱い化合物の類品の受託合成も承っております。詳しくは下記の連絡先にお問い合わせください。

東京化成工業株式会社

試薬製品について

■本社営業部 〒103-0001 東京都中央区日本橋小伝馬町 16-12 T-PLUS 日本橋小伝馬町8階
Tel: 03-3668-0489 Fax: 03-3668-0520 E-mail: Sales-JP@TCIchemicals.com

■大阪営業部 〒541-0041 大阪府大阪市中央区北浜1-1-21 第2中井ビル1階
Tel: 06-6228-1155 Fax: 06-6228-1158 E-mail: osaka-s@TCIchemicals.com

スケールアップ、受託サービス (合成・開発・製造) について

□化成品営業部 〒103-0001 東京都中央区日本橋小伝馬町 16-12 T-PLUS 日本橋小伝馬町8階
Tel: 03-5651-5171 Fax: 03-5640-8021 E-mail: finechemicals@TCIchemicals.com

弊社製品取扱店

本誌掲載の化学品は試験・研究用にのみ使用するものです。化学知識のある専門家以外の方のご使用はお避けください。品目や製品情報等、掲載内容の変更を予告なく行う場合があります。内容の一部または全部の無断転載・複製はご遠慮ください。