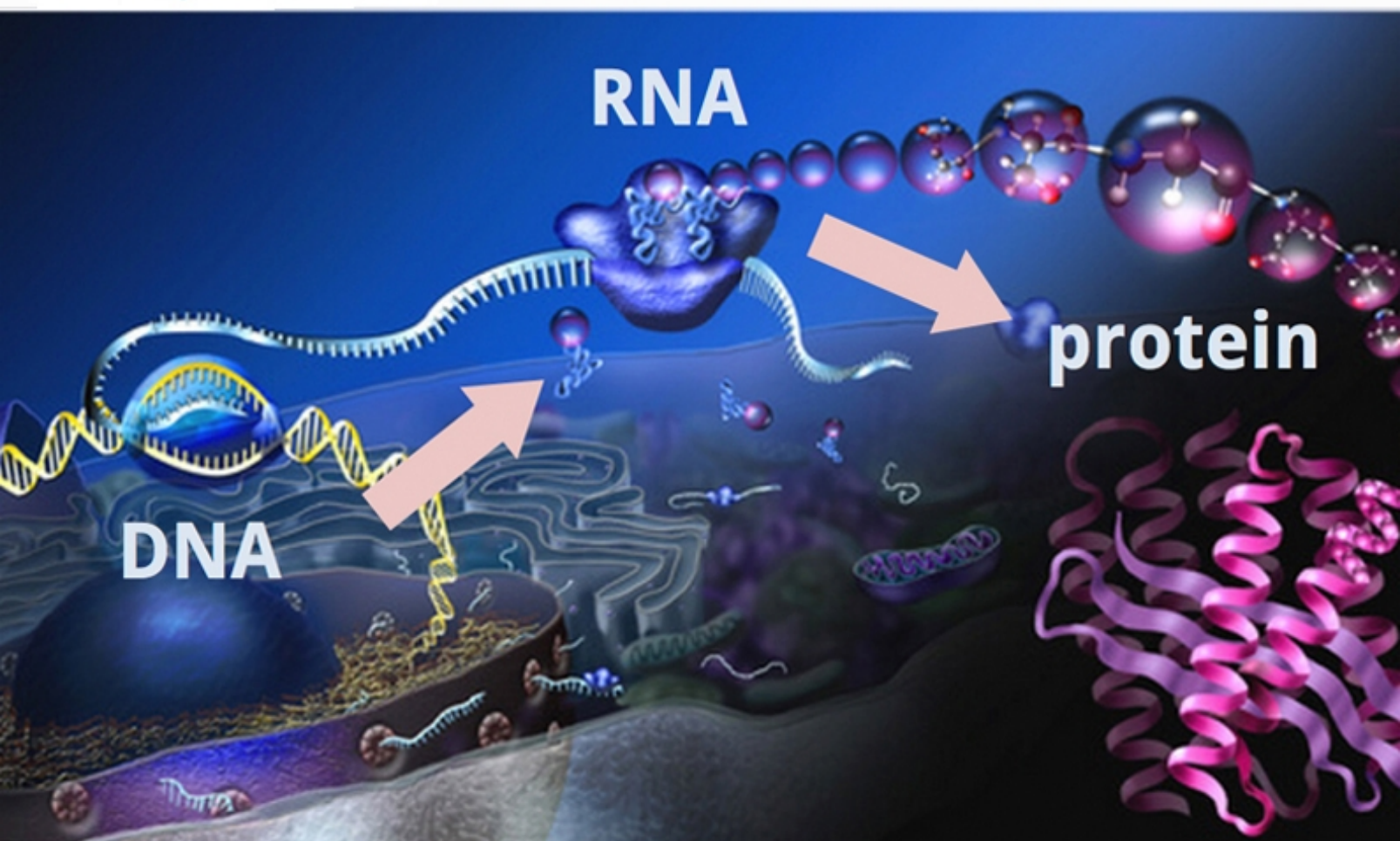




最热靶点酶水平新药筛选服务目录

iScreen™

上海唐尧生物科技有限公司

Shanghai TANG Bioscience Co. Ltd.

Perspective of Life

洞察生命

Protection of Health

呵护健康



上海唐尧生物科技有限公司
Shanghai TANG Bioscience Co., Ltd.

企 业 简 介

上海唐尧生物科技有限公司 (Shanghai TANG Bioscience Co., Ltd.) 2012年在中国上海成立了研发中心, 自创立以来一直致力于打造中国最大的医药研发筛选平台。本公司的核心团队均具有博士学位, 在大型制药企业或CRO公司从事过多年的药物筛选与开发经验, 曾成功完成多个IND的研究与申报, 涵盖药物研发的多数热点领域。公司还拥有强大的顾问团队, 他们均来自于药物研发的一线, 能够精确把握最新的药物筛选与开发的热点技术和趋势, 他们分别就职于国内外著名的科研院所、监管评审机构以及世界前十大药厂。本公司可以为客户提供最热门药物靶点相关的酶水平新药快速筛选服务, 可以极大的提高客户进行新药筛选的实验效率, 节约实验成本。本公司将以最先进的理念和最高的质量服务于客户, 以缩短客户研发周期和减少客户研发成本为服务宗旨, 在新药筛选CRO领域, 提供一如既往高品质的筛选服务, 真诚期待与您的合作!

**上海唐尧生物科技有限公司**
Shanghai TANG Bioscience Co., Ltd.

地址: 上海市闵行区华宁路200号2幢3楼

电话: 15821697315 400-018-0036

传真: 021-64828900

电子邮箱: service@tangbioscience.com.cn网址: www.tangbioscience.com.cn

服务热线: 15821697315

目 录

1. 抗肿瘤新药酶水平筛选服务

1. 1. 聚合ADP核糖聚合酶 (PARP) 抑制剂 酶水平筛选 2
- PARP1, PARP2, PARP3, PARP5A (TNKS1), PARP5B (TNKS2),
PARP6, PARP7, PARP8, PARP10, PARP11, PARP12, PARP14, PARP15
1. 2. 酪氨酸激酶抑制剂 酶水平筛选 4
- Abl-1, Abl-1 (T315I), Abl-1 (H396P), Abl-1 (M351T),
Abl-1 (Q252H), Abl-1 (Y253F), ACK1, ALK, ALK4, Axl,
BLK, BMX, BRK, BTK, CSK, c-Met, c-Met (D1246H), c-Met (M1268T),
c-Met (Y1248C), c-Met (Y1248D), c-Met, (Y1248H), c-Kit,
c-Kit (D816V), c-Kit (V560G), c-Kit (V654A), DDR1, DDR2,
EGFR, EGFR (L858R), EGFR (T790M), EGFR (L858R/T790M),
EphA1, EphA2, EphA3, EphA4, EphA6, EphB2, EphB3, EphB4,
FAK, FES, FGR, FGFR1 (V561M), FGFR1 (FLT2), FGFR2, FGFR3,
FGFR4, Flt1 (VEGFR1), Flt3, FMS (CSF1R), FRK, FYNA,
HCK, Her2, Her4, IGF-1R, Insulin Receptor, ITK, JAK1,
JAK2, JAK3, LCK, LYN-A, LYN-B, MUSK, NTKR1 (TRKA),
NTKR2 (TRKB), NTKR3 (TRKC), PDGFRa, PDGFR3, PYK2, RET,
RON, ROR1, ROR2, ROS1, Src, Syk, Tie2, TXK, Tyk2,
TYRO3, VEGFR2/KDR, VEGFR3, YES1, ZAP70;
1. 3. 蛋白酪氨酸磷酸酶 (PTP) 抑制剂 酶水平筛选 6
- PTP-Bas, PTP-D2 (PTPN14), PTP1B, SHP-1, SHP-2, TC-
PTP, CD45/PTPRC, DEP1/PTPRJ, LAR/PTPRF, PTPbeta/PTPRB,
PTPIA2, PTPmu, PTPsigma/PTPRS, RPTPg/PTPRG;

1. 4. 丝/苏氨酸激酶抑制剂筛选	7
Akt1, Akt2, Akt3, AMPK, Aurora A, Aurora B, Aurora C, B-Raf, B-Raf (V600E), C-Raf, CaMK, CDK1/CyclinA2, CDK2/CyclinA2, CDK2/CyclinE1, CDK3/CyclinE1CDK4/CyclinD3, CDK5/p25, CDK5/p35, CDK6/CyclinD1, CDK6/CyclinD3, CDK9/CyclinK, CHK1, CHK2, ERK1, ERK2, JNK1, JNK2, JNK3, MEK1, MEK2, MLCK, mTOR, PI3 Kinase (p110 α /p85 α), PI3 Kinase (p110 β /p85 α), PI3 Kinase (p110 δ /p85 α), PI3Kinase (p110 α (E542K) /p85 α), PI3 Kinase (p110 α (E545K) /p85 α), PI3 Kinase (p110 α (H1047R) /p85 α), PI3 Kinase (p110 α /p65 α), p38, p70S6K, PKA, PKC, PKD, PLK1, PLK2, PLK3, ROCK1 r ROCK2, ROCK3, TGF- β R2, ZAK;	
1. 5. 组蛋白去乙酰化酶 (HDAC) 抑制剂筛选	8
HDAC1, HDAC2, HDAC3, HDAC4, HDAC5, HDAC6, HDAC7, HDAC8, HDAC9, HDAC10, HDAC11;	
1. 6. 组蛋白去甲基化酶抑制剂筛选	10
JARID1A, JARID1B, JARID1C, JARID1D, JMJC1A, JMJC2A, JMJC2B, JMJC2C, JMJC2D, JMJC2E, JMJD3&LSD1;	
1. 7. 组蛋白甲基转移酶抑制剂筛选	12
EZH1, EZH2, G9a, GLP, MLL Complex, PRMT1, PRMT3, PRMT4, PRMT5, PRMT6, PRMT8, SETD2, SET7/9, SET8, SUV39H1, SUV39H2	
1. 8. DNA甲基转移酶抑制剂筛选	15
DNMT1, DNMT3A/3L, DNMT3B/3L;	
1. 9. 热休克蛋白90 (Hsp90) 抑制剂筛选	16
Hsp90 α , Hsp90 β ;	
1. 10. 基质金属蛋白酶2 (MMP2) 抑制剂筛选	17
1. 11. 抑制微管蛋白聚集及抑制微管蛋白解聚抗肿瘤药物筛选	18
1. 12. 蛋白酶体 (Proteasome 26S) 抑制剂筛选	19
1. 13. 多药耐药 (MDR) 相关的P糖蛋白抑制剂筛选	20
1. 14. 拓扑异构酶I型及II型抑制剂筛选	21

2. 抗糖尿病新药酶水平筛选服务

2.1. 二肽基肽酶（DPP）抑制剂酶水平筛选 23

DPP3, DPP4, DPP7, DPP8, DPP9, FAP, POP;

2.2. 去乙酰化酶Sirtuin抑制剂酶水平筛选 24

Sirtuin1, Sirtuin2, Sirtuin3, Sirtuin5, Sirtuin6;

2.3. 过氧化物酶体增殖剂激活受体激动剂酶水平筛选 25

PPAR α , PPAR β/δ , PPAR γ ;

2.4. 其他与代谢相关的酶抑制剂酶水平筛选 26

Acetyl Coenzyme A carboxylase 1

Acetyl Coenzyme A carboxylase 2, Amylase,

Arachidonate 15-lipoxygenase, ATP Citrate Lyase,

Carbonic Anhydrase 1, Carbonic Anhydrase 2

Fucokinase, Formaldehyde dehydrogenase, Galactokinase

Isocitrate Dehydrogenase 1,

Isocitrate Dehydrogenase 2, Lipase,

Methylthioadenosine phosphorylase,

Nicotinamide phosphoribosyltransferase,

Nicotinamide nucleotide adenylyltransferase 1,

Pyruvate kinase M1, Pyruvate kinase M2;

3. 其他靶点新药筛选服务

3. 1. 磷酸二酯酶（PDE）抑制剂筛选 28

PDE1A1, PDE1B, PDE1C, PDE2A1, PDE3A, PDE3B, PDE4A1A, PDE4B1, PDE4B2, PDE4C1, PDE4D2, PDE4D3, PDE4D7, PDE5A, PDE6C, PDE7A, PDE7B, PDE8A1, PDE9A, PDE10A1, PDE10A2, PDE11A;

3. 2. 磷脂酶A (PLA) 抑制剂筛选 30

PLA2 G12A, PLA2 G12B, PLA2 G4A, PLA2 G7;

3. 3. 调节血脂药物筛选 31

PCSK9 (Proprotein convertase subtilisin/kexin 9);

3. 4. 抗病毒药物筛选 32

HCV NS3/4A Protease, HRV3C Protease;
Influenza H1N1 Neuraminidase, HIV Integrase;

3. 5. 抗凝血药物筛选 33

Factor Xa, Coagulation factor XIV, Thrombin;

3. 6. 抗高血压药物筛选 34

Renin, Angiotensinase C;

3. 7. 溴结构域 (BRD) 蛋白抑制剂筛选 35

CREBBP, ATAD2A, ATAD2B, BAZ2B, BRD1, BRD2 (BD1),
BRD2 (BD2), BRD2 (BD1 + BD2), BRD3 (BD1), BRD3 (BD2)
BRD3 (BD1 + BD2), BRD4 (BD1), BRD4 (BD2), BRD4 (BD1
+ BD2), BRD9 (BD1), BRDT (BD1), BRPF3, TAF1 (BD2),
TAF1 (BD1 + BD2), TAF1L (BD2), TAF1L (BD1 + BD2)
TRIM24 (TIF1);

3. 8. 组织蛋白酶相关药物筛选 37

Cathepsin B, Cathepsin F, Cathepsin L, Cathepsin S,
Cathepsin V;

3. 9. 凋亡相关药物筛选 38

Caspase 3, Caspase 6, Caspase 7, Caspase 8;

3. 10. 泛素相关药物筛选 39

泛素活化酶 (E1): UBA6 (UBE1L2), UBE1;
泛素交联酶 (E2): Ubch13 (UBE2N), Ubch5a,
Ubch6 (UBE2E1), Ubch7 (UBE2L3), 9 UEV1A (UBE2V1);
泛素连接酶 (E3): Mdm2 (Hdm2), 11 MYLIP/IDOL, Nedd4,
RNF20, SMURF1, SMURF2, UBE3A, UHRF1 (2-793), WWP1;
去泛素化酶: A20 (TNFAIP3), Ataxin-3, OTUD6B, UCHL1,
UCHL3, USP10, USP14, USP2, USP2, USP5 (IsoT), USP7, USP8;

超低价格 震撼来袭

1. 筛选价格低：检测一个化合物酶水平IC₅₀值仅需990元；
2. 筛选质量高：实验数据重复性好，内参阳性药与文献数据相同；
3. 筛选速度快：两至三周出报告；
4. 筛选项目全：192种热门靶点；
5. 筛选保密性强：签署保密协议；
6. 先筛选后付费：客户对实验结果不满意，保证全额退款；
7. 已经为中科院上海药物研究所、上海交大药学院、上海医工所等院校的众多老师提供了筛选服务；

测一个IC₅₀值

990元

请拨打：15821697315

上海唐尧生物科技有限公司
Shanghai TANG Bioscience Co. Ltd.

地址：上海市闵行区华宁路200号2幢3楼

电话：15821697315 400-018-0036

传真：021-64828900

电子邮箱：service@tangbioscience.com.cn

网址：www.tangbioscience.com.cn

1. 抗肿瘤新药酶水平筛选服务

1. 1. 聚合ADP核糖聚合酶（PARP）抑制剂筛选

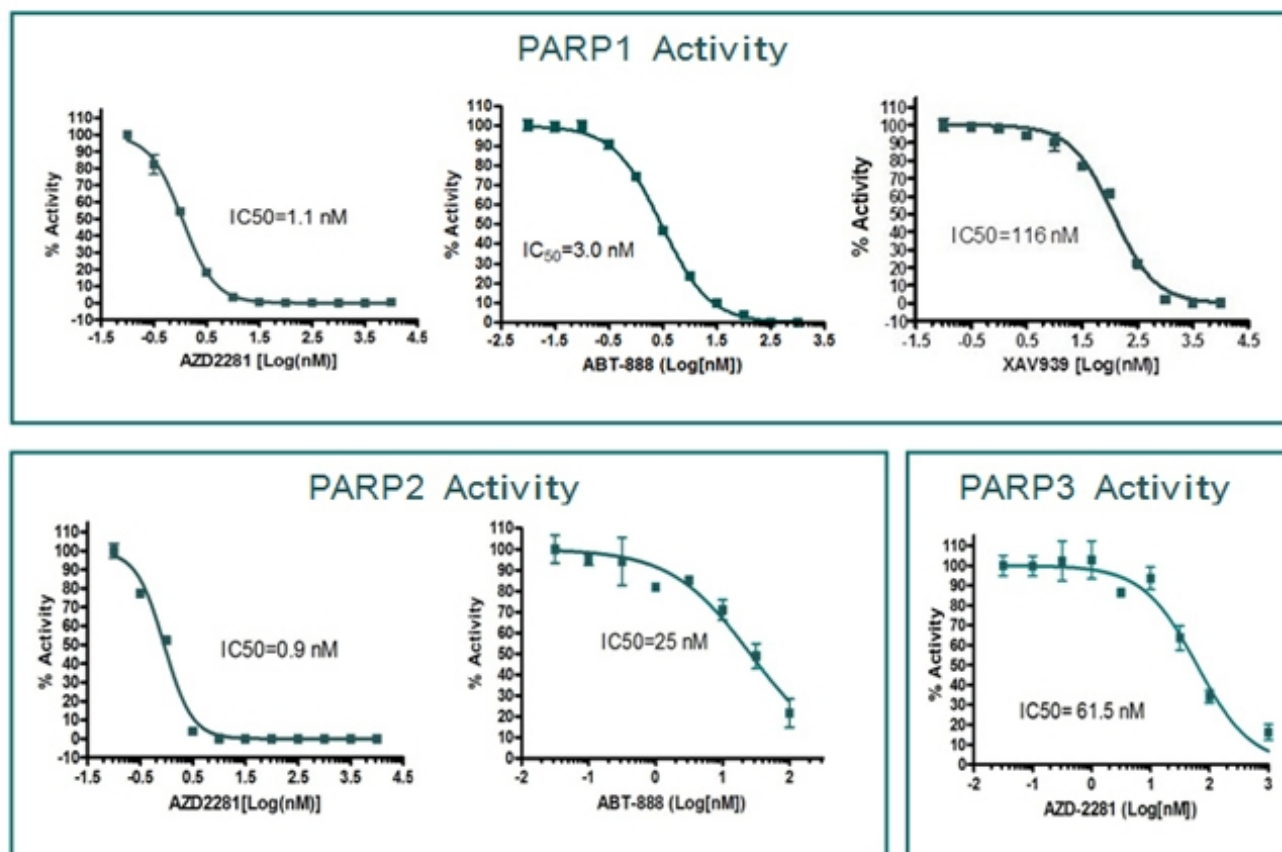
【生物背景】

PARP酶在细胞DNA修复、染色体结构维持、及凋亡方面都具有非常重要的作用。许多种类的肿瘤细胞中均存在着PARP酶过表达，而这又与肿瘤的侵袭特性及对各种作用于DNA的化疗药物产生的耐药性紧密相关。PARP抑制剂作为一种新类型的抗肿瘤药物，已经在临床上对于PTEN、BRCA1、BRCA2发生突变的乳腺癌及卵巢癌病人产生了非常确切的疗效。

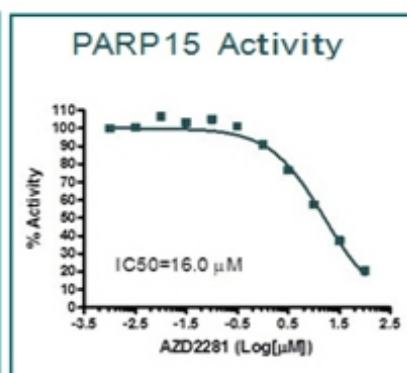
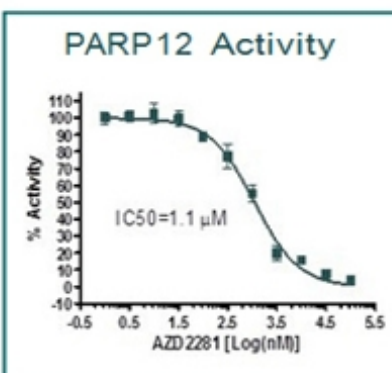
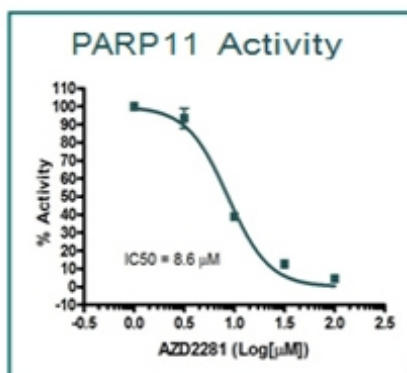
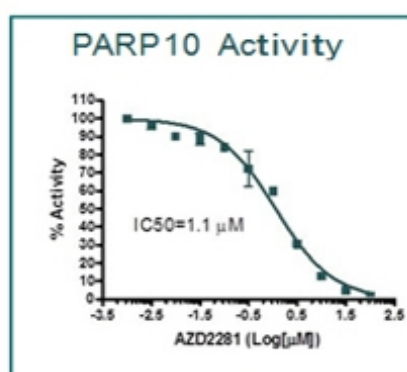
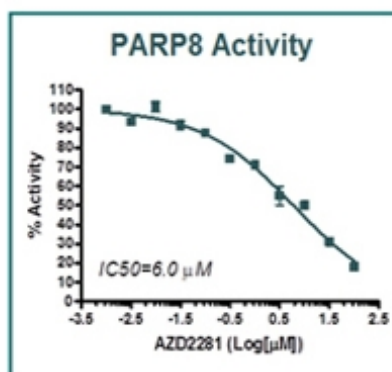
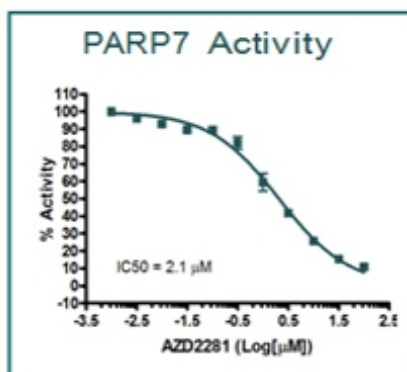
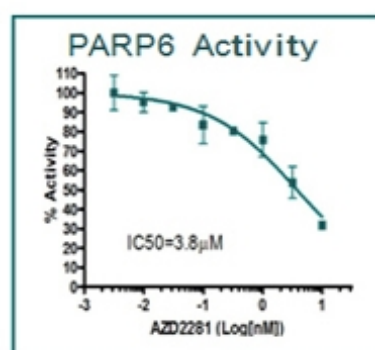
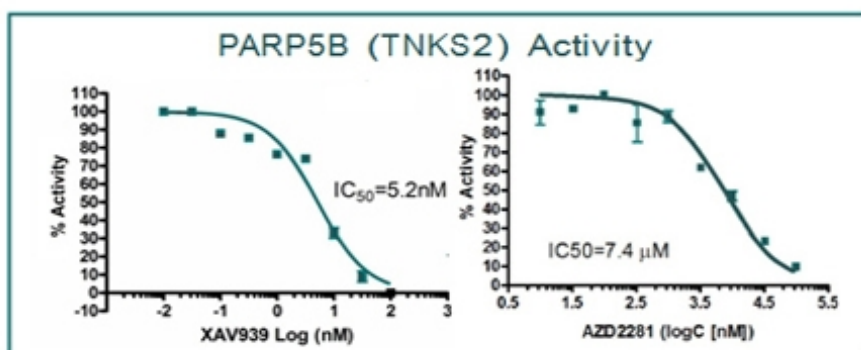
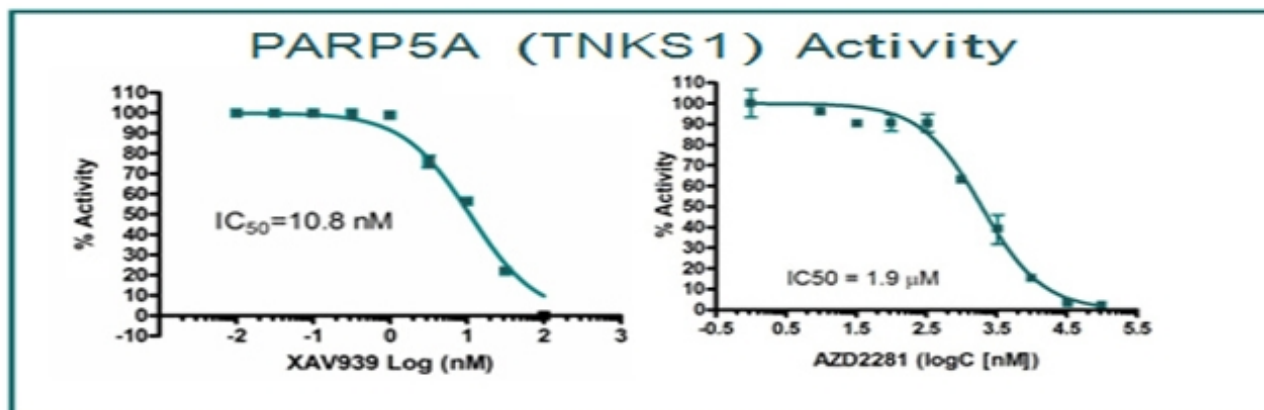
【筛选项目】

PARP Assays		
PARP1	PARP5B (TNKS2)	PARP10
PARP2	PARP6	PARP11
PARP3	PARP7	PARP12
PARP5A (TNKS1)	PARP8	PARP15 PARP14

【结果示例】



【结果示例】



1.2. 酪氨酸激酶抑制剂筛选

【生物背景】

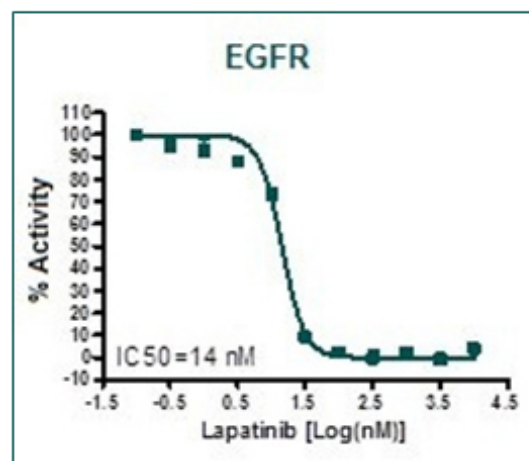
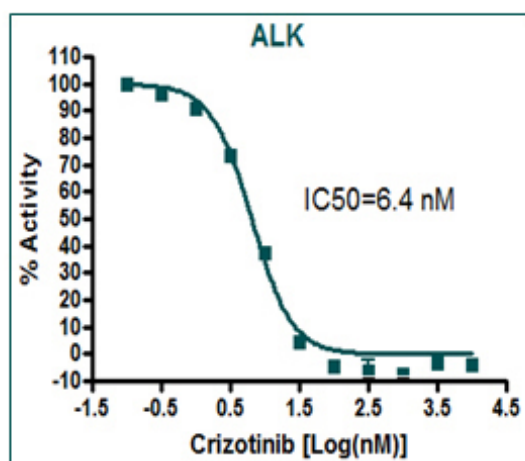
酪氨酸激酶 (protein tyrosine kinase, PTK) 是一类具有酪氨酸激酶活性的蛋白质，在癌细胞内的信号转导通路中占据了十分重要的地位，调节着癌细胞体内生长、分化、凋亡等一系列生理过程。它们能催化ATP 上的磷酸基转移到许多重要蛋白质的酪氨酸残基上，使其发生磷酸化，从而介导癌细胞外信号跨过细胞膜传递到细胞内。基于是否具有结合配体的细胞外受体结构和跨膜区域，蛋白酪氨酸激酶可分为受体型和非受体型两种。

【筛选项目】

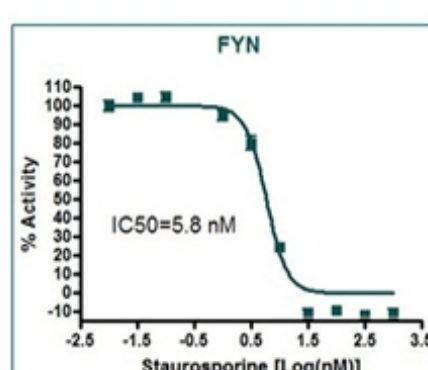
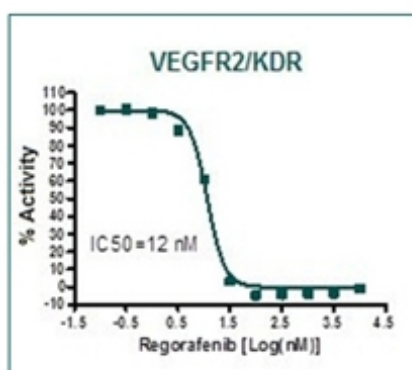
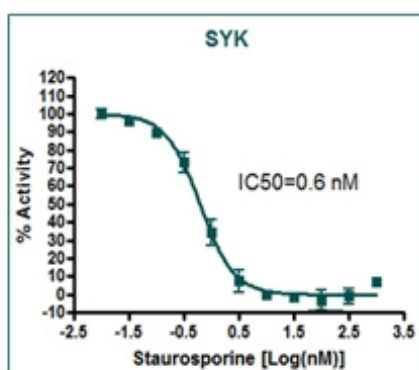
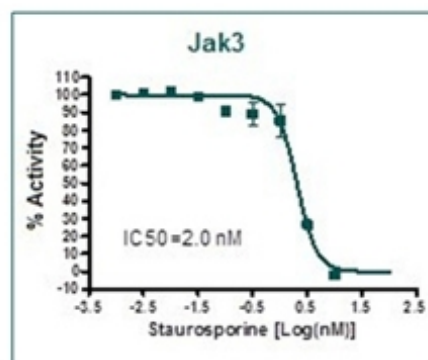
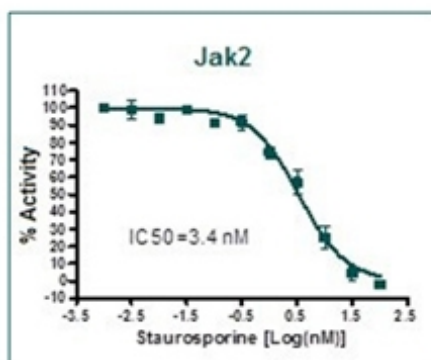
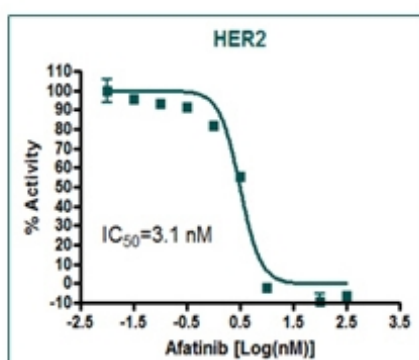
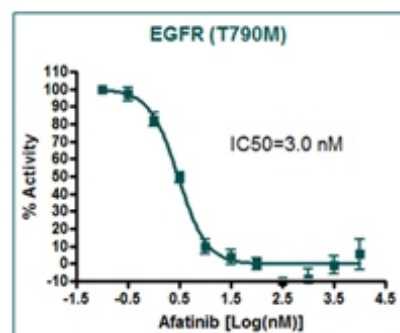
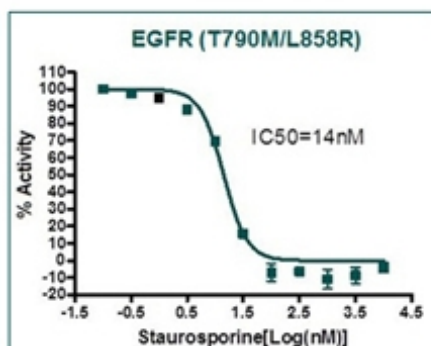
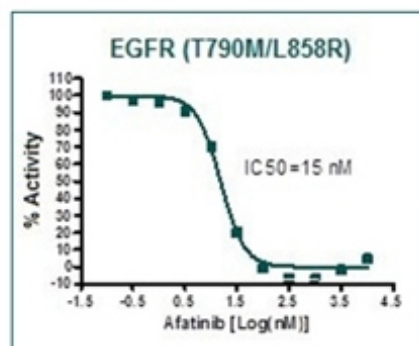
Tyrosine Kinase Assays

Abl-1, Abl-1 (T3151), Abl-1 (H396P), Abl-1 (M351T), Abl-1 (Q252H), Abl-1 (Y253F), ACK1, ALK, ALK4, Axl, BLK, BMX, BRK, BTK, CSK, c-Met, c-Met (D1246H), c-Met (M1268T), c-Met (Y1248C), c-Met (Y1248D), c-Met (Y1248H), c-Kit, c-Kit (D816V), c-Kit (V560G), c-Kit (V654A), DDR1, DDR2, EGFR, EGFR (L858R), EGFR (T790M), EGFR (L858R, T790M), EphA1, EphA2, EphA3, EphA4, EphA6, EphB2, EphB3, EphB4, FAK, FES, FGR, FGFR1 (V561M), FGFR1 (FLT2), FGFR2, FGFR3, FGFR4, F1t1 (VEGFR1), F1t3, FMS (CSF1R), FRK, FYNA, HCK, Her2, Her4, IGF-1R, Insulin Receptor, ITK, JAK1, JAK2, JAK3, LCK, LYN-A, LYN-B, MUSK, NTKR1 (TRKA), NTKR2 (TRKB), NTKR3 (TRKC), PDGFRa, PDGFR3, PYK2, RET, RON, ROR1, ROR2, ROS1, Src, Syk, Tie2, TXK, Tyk2, TYRO3, VEGFR2/KDR, VEGFR3, YES1, ZAP70;

【结果示例】



【结果示例】



1.3. 蛋白酪氨酸磷酸酶(PTP)抑制剂筛选

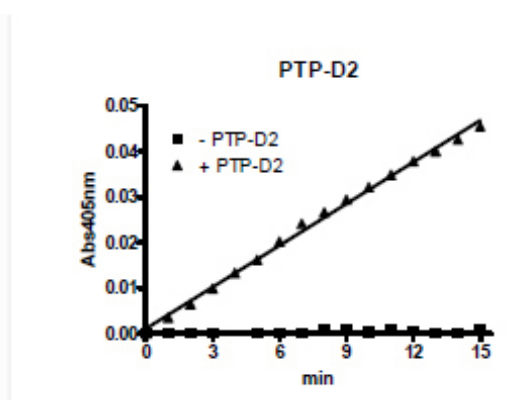
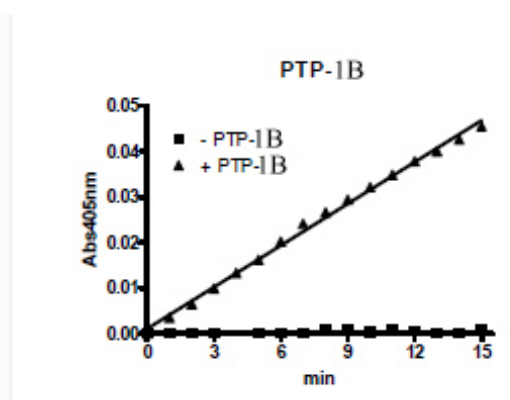
【生物背景】

磷酸酶(phosphatase)是一种能够将对应底物去磷酸化的酶,磷酸酶的作用与激酶的作用正相反,磷酸化可以使一个酶被激活或失活,也可以使一个蛋白-蛋白间相互作用发生(如SH3结构域)。磷酸之所以对于信号传导很重要,其原因在于它能够对其所结合的蛋白的行动进行调控;而除去磷酸,则是一种反向作用(如果磷酸化是激活作用,则去磷酸化就是抑制作用),磷酸酶就在这里扮演了重要的角色。

【筛选项目】

Phosphatase Assays		
PTP-Bas	TC-PTP	PTPIA2
PTP-D2(PTPN14)	CD45/PTPRC	PTPmu
PTP1B	DEP1/PTPRJ	PTPsigma/PTPRS
SHP-1	LAR/PTPRF	RPTPg/PTPRG
SHP-2	PTPbeta/PTPRB	

【结果示例】



1. 4. 丝/苏氨酸激酶抑制剂筛选

【生物背景】

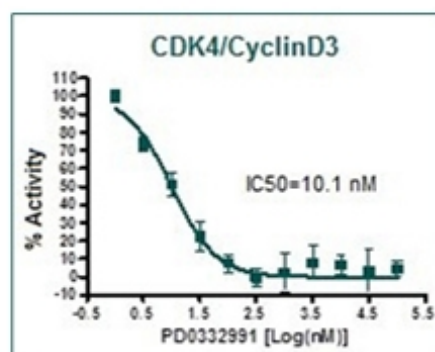
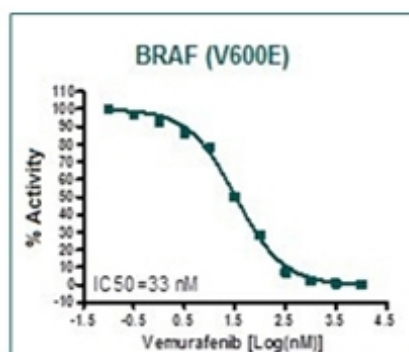
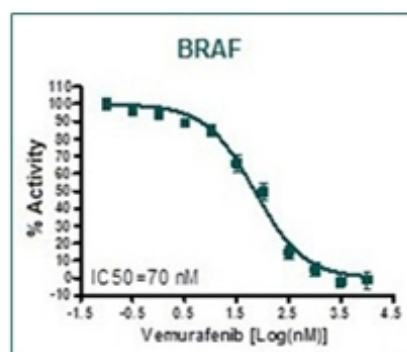
丝氨酸/苏氨酸激酶 (serine/threonine kinases) 是具有丝氨酸/苏氨酸蛋白激酶活性，主要使下游信号蛋白中的丝氨酸或苏氨酸磷酸化，把细胞外的信号传入细胞内，再通过影响基因转录来达到多种生物学功能。这些激酶具有类似结构与功能，对细胞具有多方面的效应。依细胞类型不同，可能抑制细胞增殖、刺激胞外基质合成、刺激骨骼的形成、通过趋化性吸引细胞和作为胚胎发育过程中的诱导信号等。

【筛选项目】

Serine/Threonine Kinase Assays

Akt1, Akt2, Akt3, AMPK, Aurora A, Aurora B, Aurora C, B-Raf, B-Raf (V600E), C-Raf, CaMK, CDK5/p35, CDK6/Cyclin D3, CDK4 (EE, T172A) /Cyclin D1, CDK1/CyclinA2, CDK2/CyclinA2, CDK2/CyclinE1, CDK3/CyclinE1, CDK4/CyclinD3, CDK5/p25, CDK6/CyclinD1, CDK7/CyclinH1/MNAT1, CDK9/CyclinK, CHK1, CHK2, ERK1, ERK2, JNK1, JNK2, JNK3, MEK1, MEK2, MLCK, mTOR, PI3 Kinase (p110 α /p85 α), PI3 Kinase (p110 β /p85 α), PI3 Kinase (p110 δ /p85 α), PI3 Kinase (p110 α (E542K) /p85 α), PI3 Kinase (p110 α (E545K) /p85 α), PI3 Kinase (p110 α (H1047R) /p85 α), PI3 Kinase (p110 α /p65 α), p38, p70S6K, PKA, PKC, PKD, PLK1, PLK2, PLK3, ROCK1, ROCK2, ROCK3, TGF- β R2, ZAK;

【结果示例】



1.5. 组蛋白去乙酰化酶 (HDAC) 抑制剂筛选

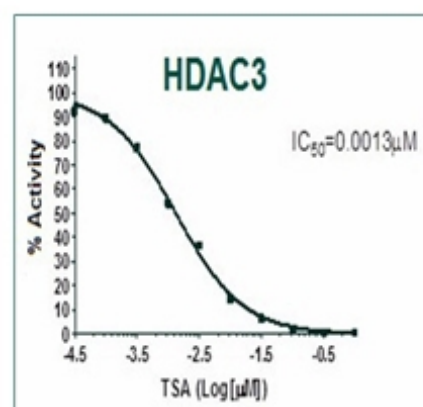
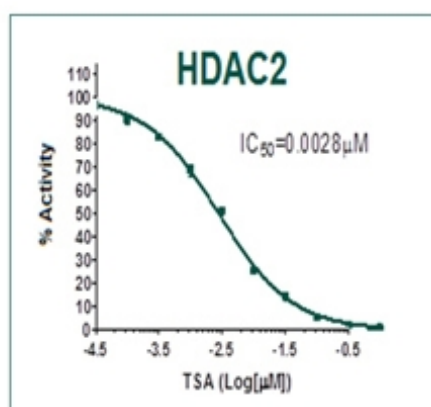
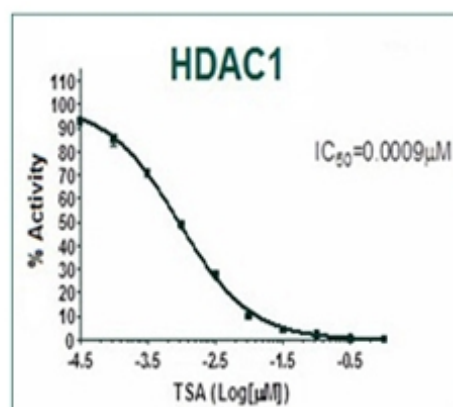
【生物背景】

组蛋白去乙酰化酶 (HDAC) 是一类蛋白酶, 对染色体的结构修饰和基因表达调控发挥着重要的作用。一般情况下, 组蛋白的乙酰化有利于DNA与组蛋白八聚体的解离, 核小体结构松弛, 从而使各种转录因子和协同转录因子能与DNA结合位点特异性结合, 激活基因的转录。在癌细胞中, HDAC的过度表达导致去乙酰化作用的增强, 通过恢复组蛋白正电荷, 从而增加DNA与组蛋白之间的引力, 使松弛的核小体变得十分紧密, 不利于特定基因的表达, 包括一些肿瘤抑制基因。组蛋白去乙酰化酶抑制剂则可通过提高染色质特定区域组蛋白乙酰化, 从而调控细胞凋亡及分化相关蛋白的表达和稳定性, 诱导细胞凋亡及分化, 成为一类新的抗肿瘤药物。

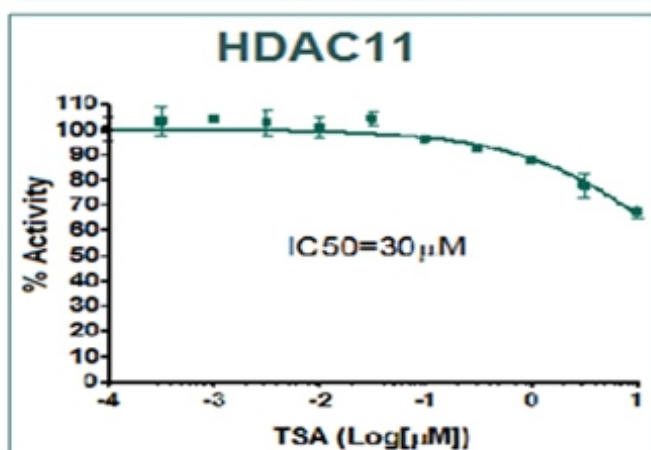
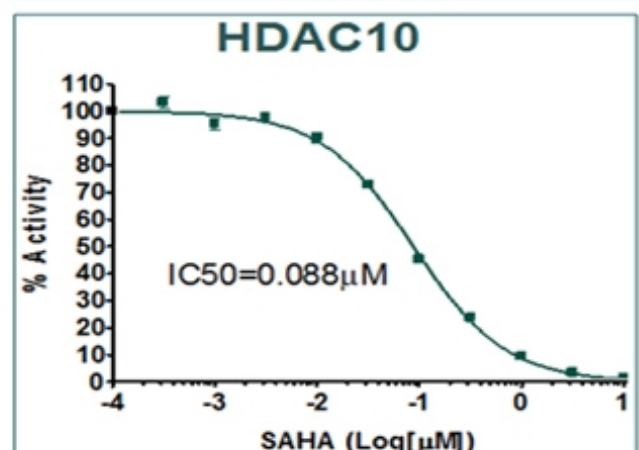
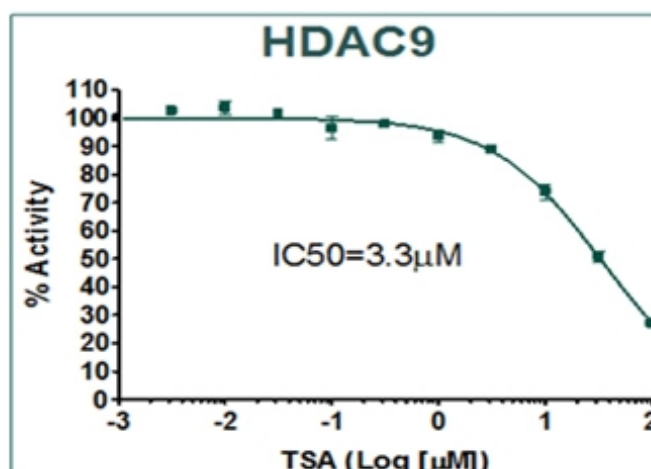
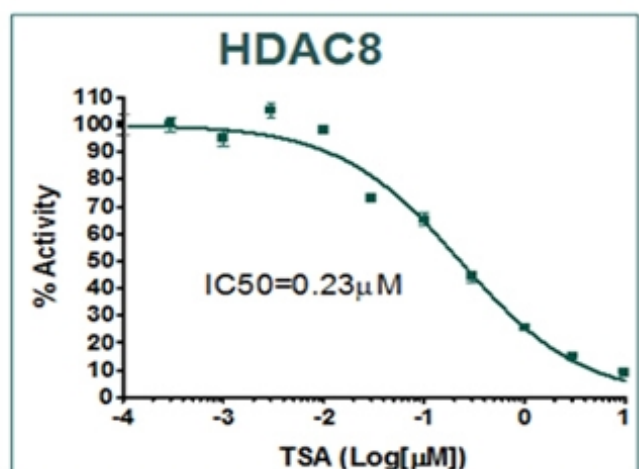
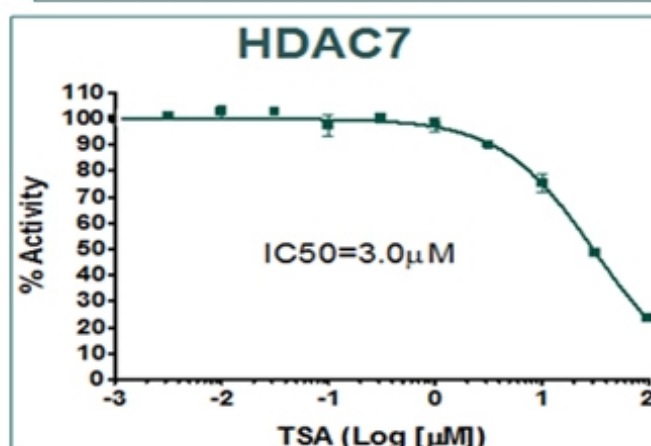
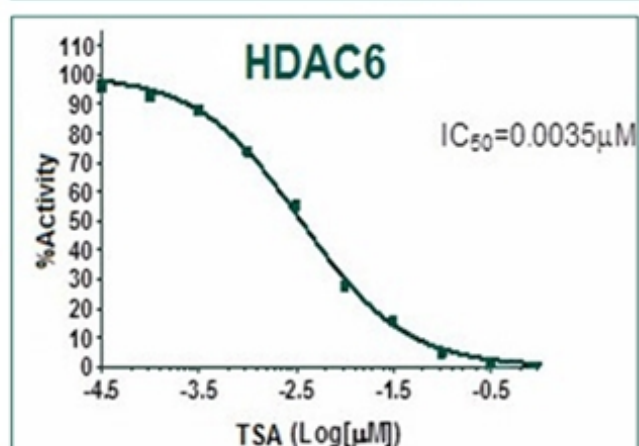
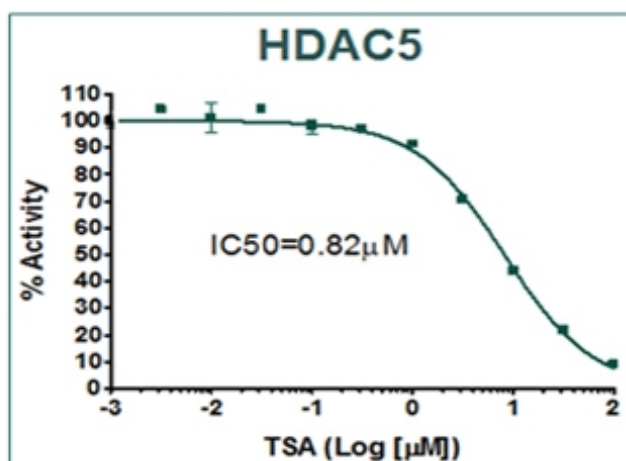
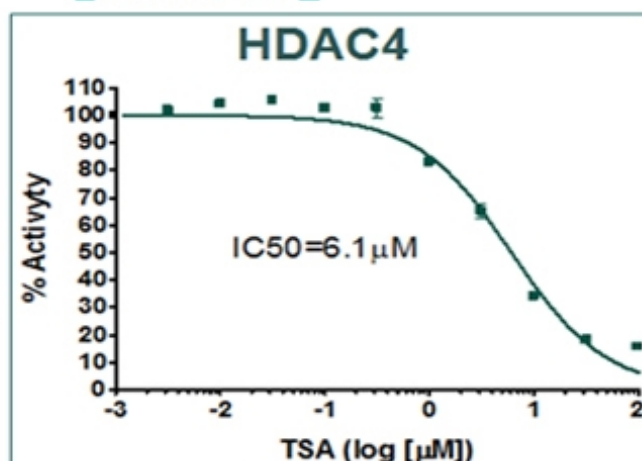
【筛选项目】

HDAC Assays		
HDAC 1	HDAC 5	HDAC 9
HDAC 2	HDAC 6	HDAC 10
HDAC 3	HDAC 7	HDAC 11
HDAC 4	HDAC 8	

【结果示例】



【结果示例】



1. 6. 组蛋白去甲基化酶抑制剂筛选

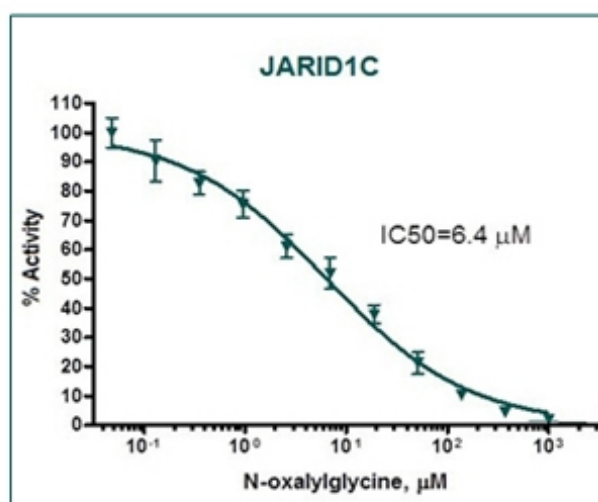
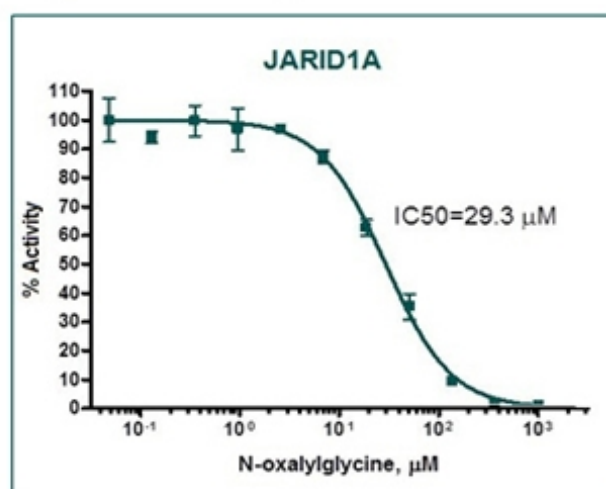
【生物背景】

组蛋白去甲基化酶是可以脱去组蛋白甲基化的一类酶，有LSD1和JMJC等家族，第一个组蛋白的去甲基化酶LSD1在FAD的参与下，LSD1在可以特异去掉H3K4的二甲基和一甲基修饰及H3K9的二甲基和一甲基修饰，LSD1不能去掉赖氨酸的三甲基修饰。JMJC家族去甲基化酶需要铁离子和 α -酮戊二酸参与反应，可以去掉赖氨酸的三甲基化修饰，可以相应的影响端粒的长度，是作为表观遗传修饰的重要途径，可能调控机体增殖，衰老，肿瘤发生等重要生物学过程。

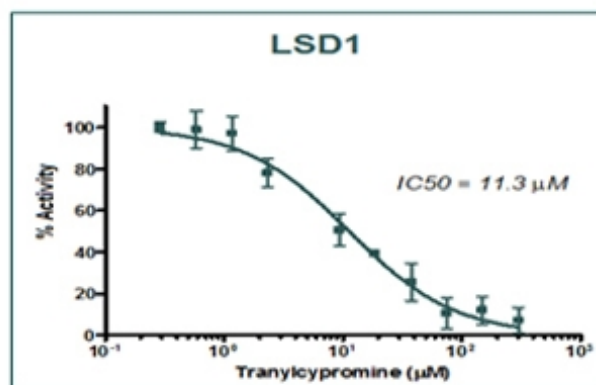
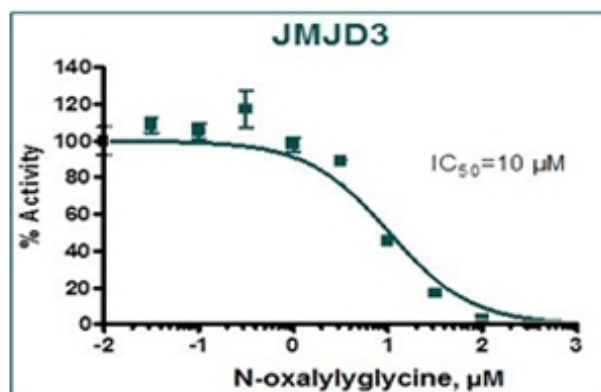
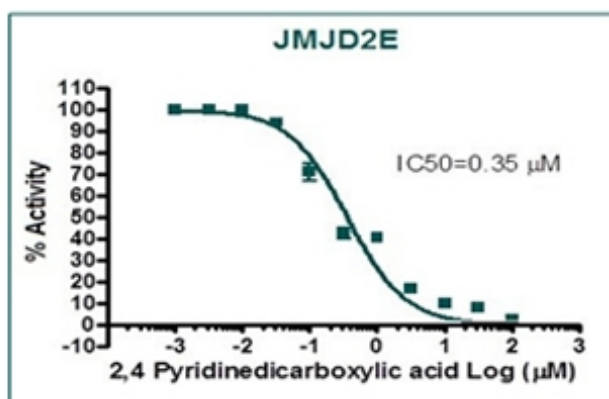
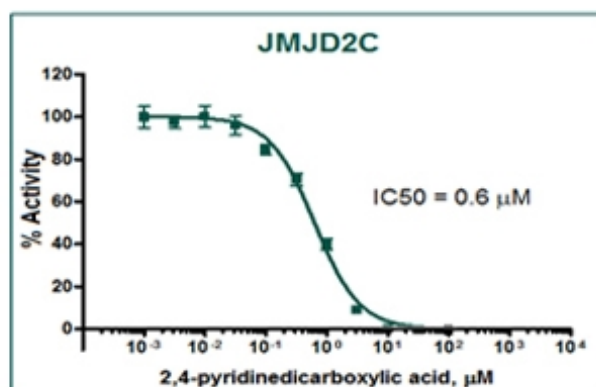
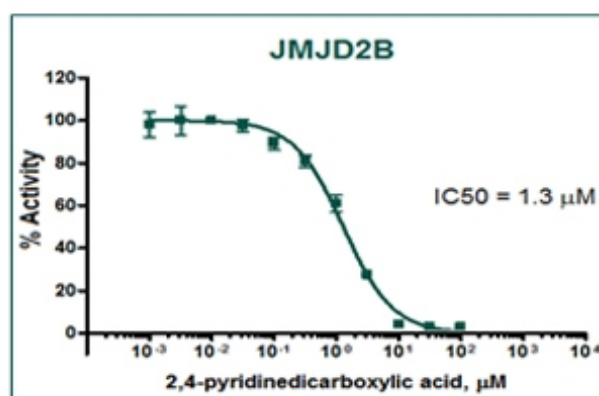
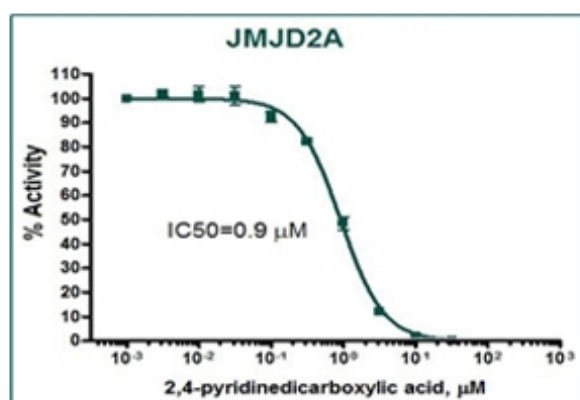
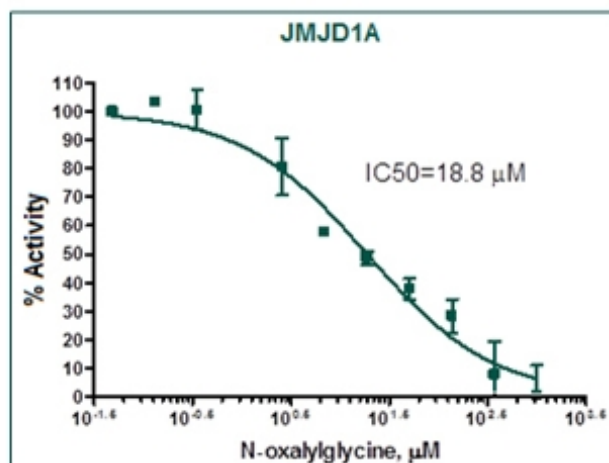
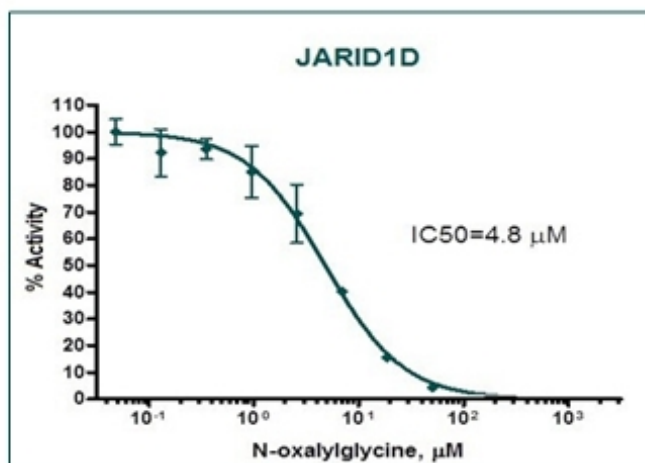
【筛选项目】

Histone Demethylase Assays		
JARID1A	JMJC1A	JMJC2D
JARID1B	JMJC2A	JMJC2E
JARID1C	JMJC2B	JMJD3&LSD1
JARID1D	JMJC2C	

【结果示例】



【结果示例】



1.7. 组蛋白甲基转移酶抑制剂筛选

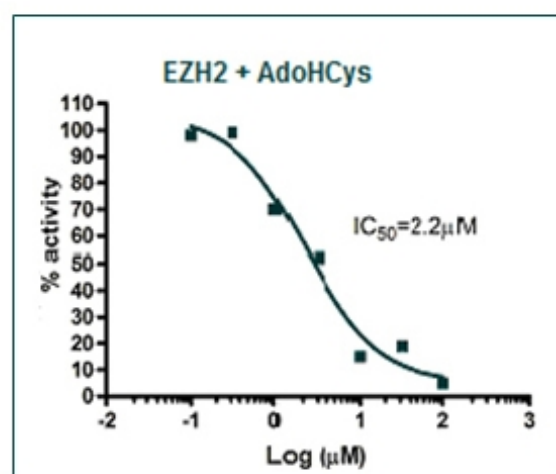
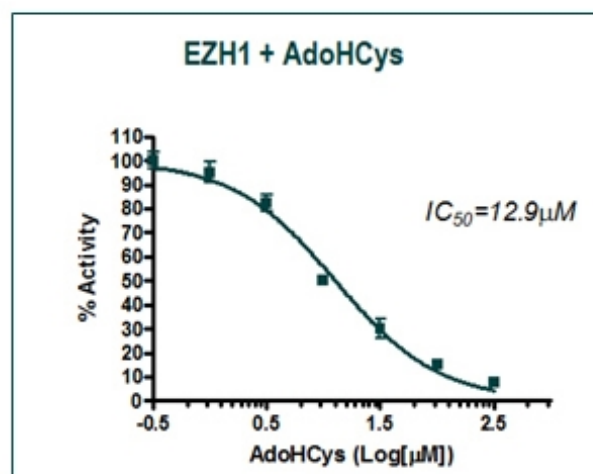
【生物背景】

组蛋白甲基转移酶 (Histone methyltransferase, HMT) 是一类针对组蛋白赖氨酸n-甲基转移酶和组蛋白精氨酸n-甲基转移酶。从辅酶-S-腺苷蛋氨酸及赖氨酸和精氨酸残留的蛋白, HMT可以作催化一至三个甲基集团的转移作用。组蛋白甲基转移酶在遗传过程中进行基因调控。甲基化的组蛋白基因结合更加紧密, 可以抑制遗传转录。

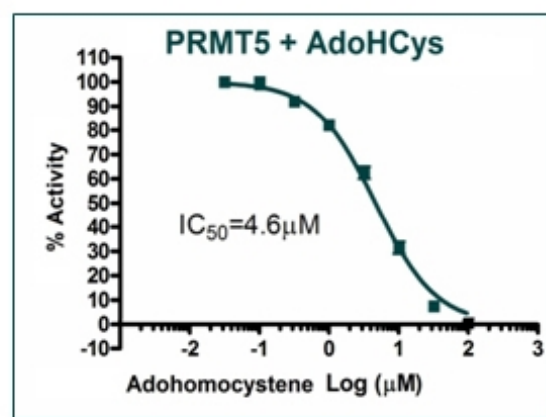
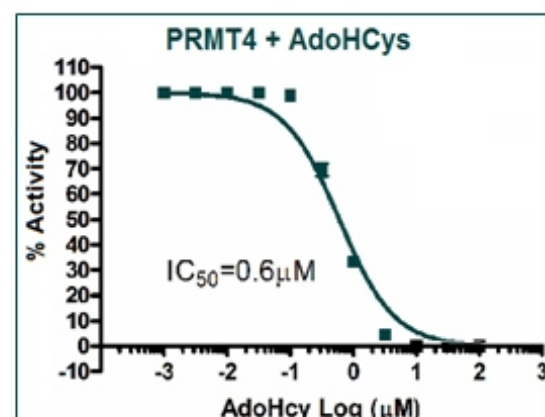
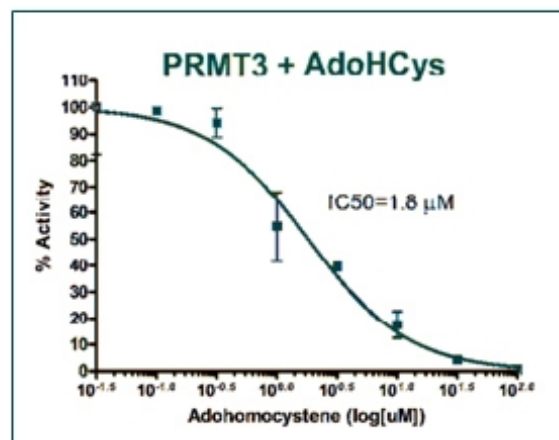
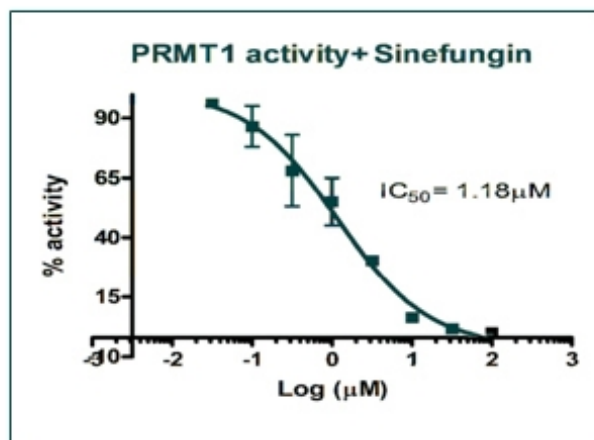
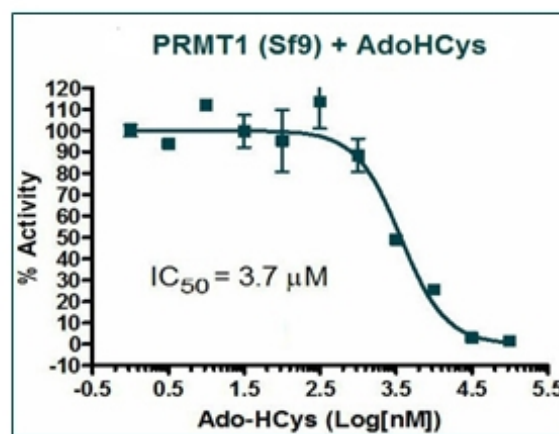
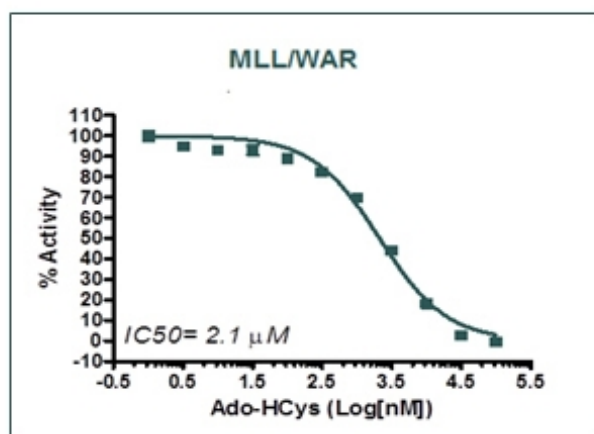
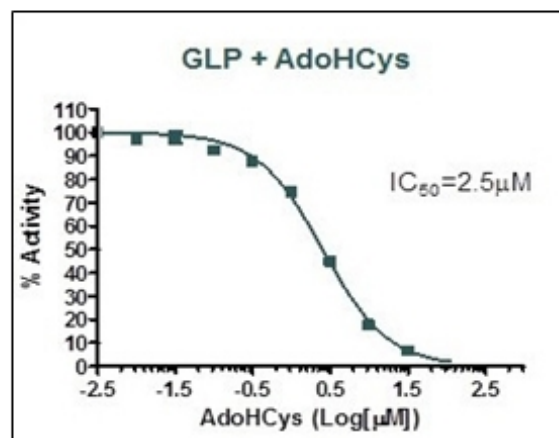
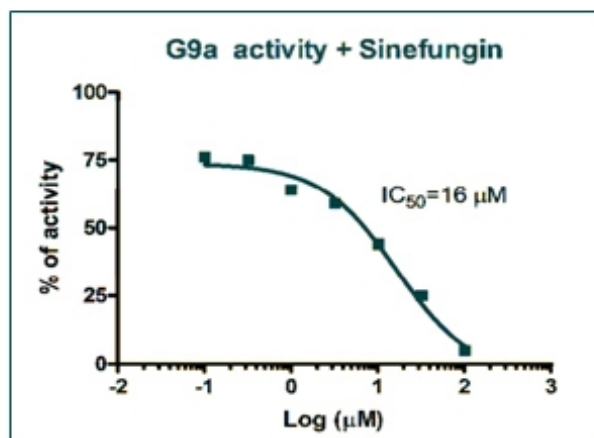
【筛选项目】

Histone Methyltransferase Assays		
EZH1	PRMT1	SETD2
EZH2	PRMT3	SET7/9
G9a	PRMT4	SET8
GLP	PRMT5	SUV39H1
MLL Complex	PRMT6	SUV39H2
	PRMT8	

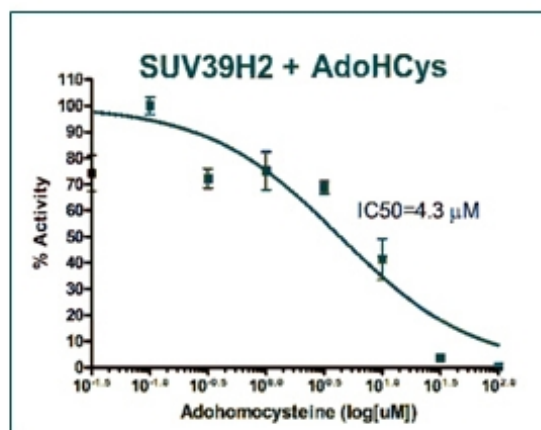
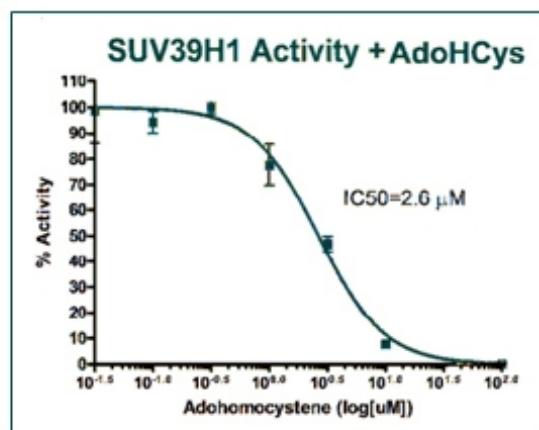
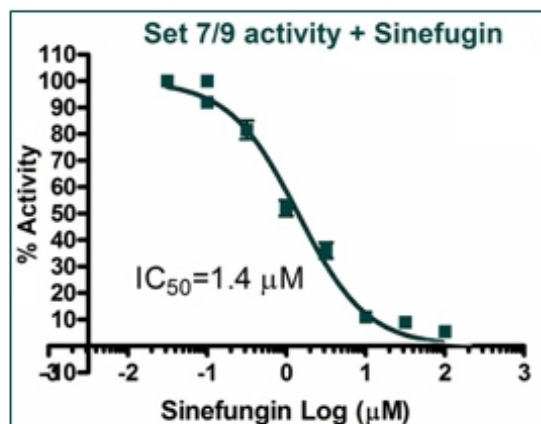
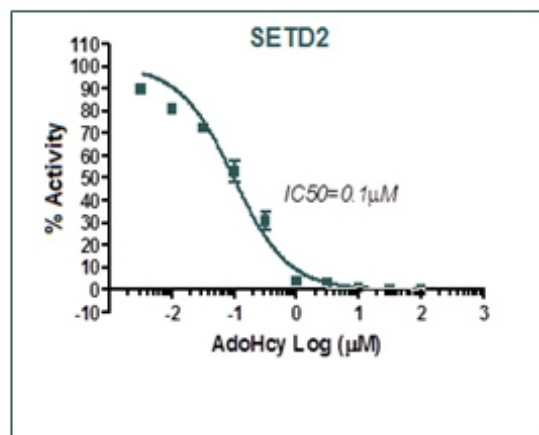
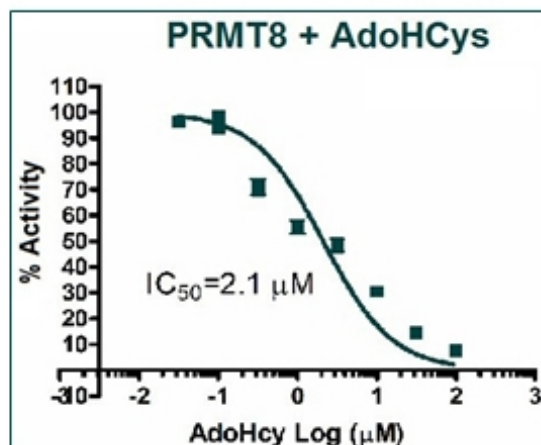
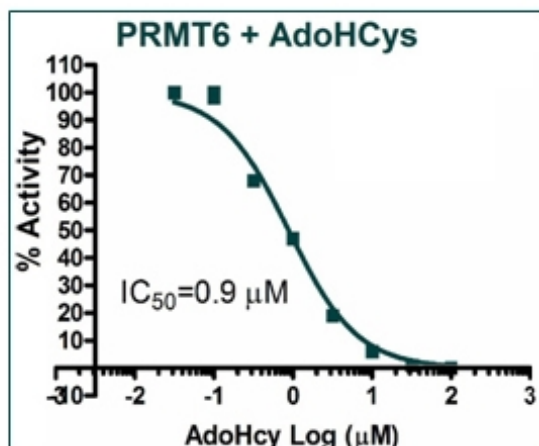
【结果示例】



【结果示例】



【结果示例】



1. 8. DNA甲基转移酶抑制剂筛选

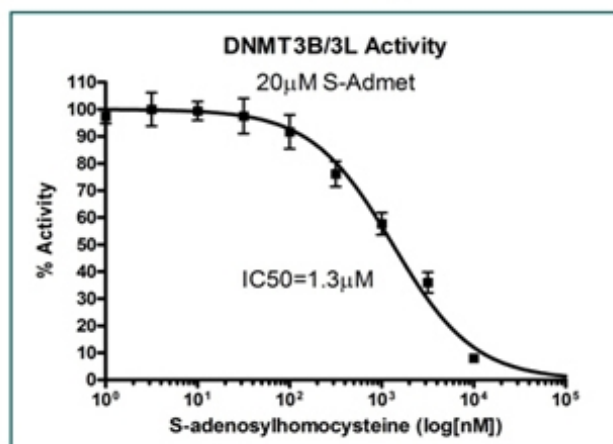
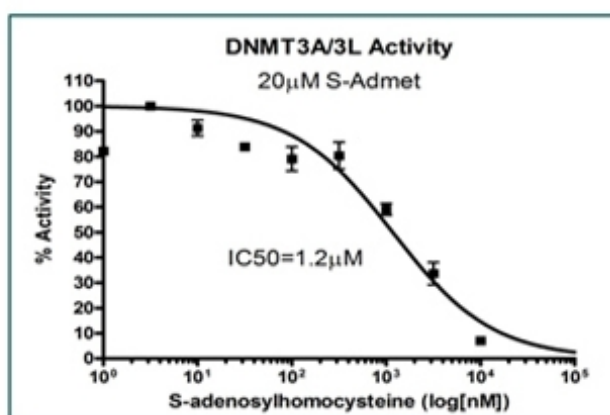
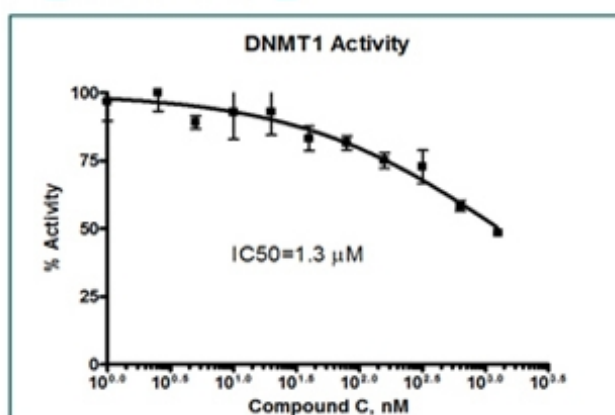
【生物背景】

在哺乳动物中，目前已发现4种DNA甲基转移酶(DNMTs)，根据结构和功能的差异分为两大类：分别以Dnmt1和Dnmt3为代表。前者主要参与甲基化状态的维持，也是非CpG位点从头甲基化所必需，并与甲基化状态的延伸有关；后者包括Dnmt3a、Dnmt3b，以及Dnmt3L等，是主要的从头甲基化酶，而Dnmt2的归属和功能尚不十分明确。

【筛选项目】

DNA Methyltransferase Assays		
DNMT1	DNMT3A/3L	DNMT3B/3L

【结果示例】



1.9. 热休克蛋白90 (Hsp90) 抑制剂筛选

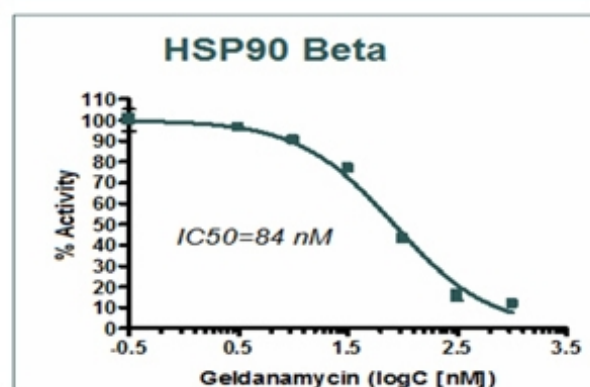
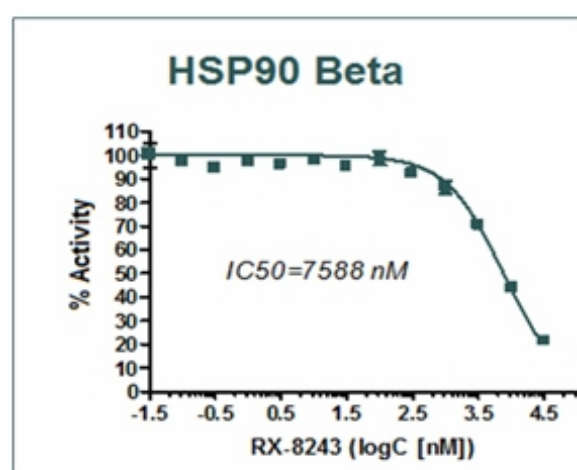
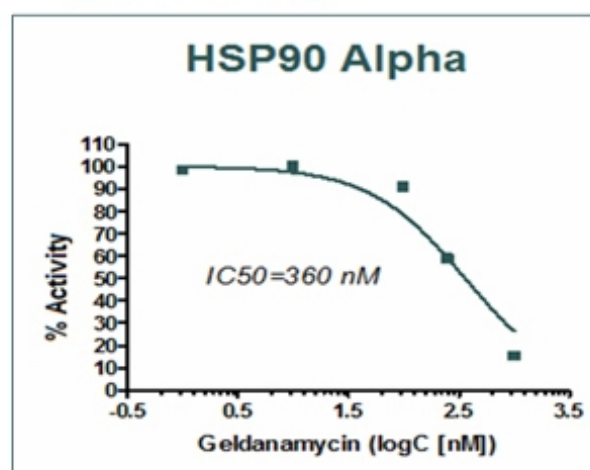
【生物背景】

热休克蛋白90 (Hsp90) 的分布极为广泛，具有多种生物功能，包括赋予细胞以耐热性以抵抗高温，作为分子伴侣以防止蛋白聚集，对抗正常的细胞死亡，从而调节细胞的生存和死亡的平衡。热休克蛋白90可以增强肿瘤细胞在恶劣环境下的耐受性，防止细胞的凋亡，众多与增殖有关的癌蛋白都是热休克蛋白90的客户蛋白，相应的，如果抑制了热休克蛋白90的功能，可以引起这些客户蛋白的降解，从而产生抗肿瘤作用。

【筛选项目】

Hsp90 Assays	
Hsp90 α	Hsp90 β

【结果示例】



1. 10. 基质金属蛋白酶2 (MMP2) 抑制剂筛选

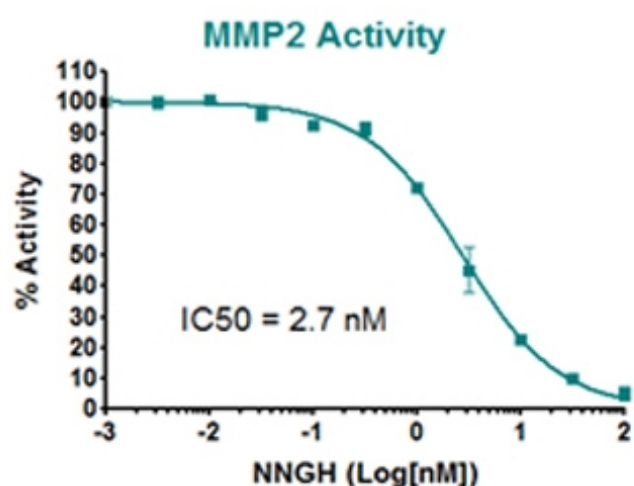
【生物背景】

MMPs几乎能降解ECM中的各种蛋白成分, 破坏肿瘤细胞侵袭的组织学屏障, 在肿瘤侵袭转移中起关键性作用, 从而在肿瘤浸润转移中的作用日益受到重视, 被认为是该过程中主要的蛋白水解酶。目前MMPs家族已分离鉴别出26个成员, 编号分别为MMP1~26。根据作用底物以及片断同源性, 将MMPs分为6类, 为胶原酶、明胶酶、基质降解素、基质溶解素、furin活化的MMP和其他分泌型MMP。

【筛选项目】

MMP Assays
MMP2

【结果示例】



1.11. 抑制微管聚集及抑制微管解聚抗肿瘤药物筛选

【生物背景】

微管是一种重要的细胞骨架蛋白，它在细胞形态的维持，胞内物质的运输，细胞的运动，细胞的极性以及有丝分裂的进行等方面都发挥了极其重要的作用。由于细胞周期调控失衡是导致肿瘤发生的主要原因，因此，微管已成为了一个重要的抗肿瘤靶点。一直以来，以微管为靶点的小分子药物受到了人们广泛的关注。它们通过抑制或促进微管的聚集，使细胞阻滞在G2/M期，最终抑制肿瘤的生长。如图1所示，微管靶向药物主要分为两大类：一类以紫杉醇（paclitaxel）为代表，包括多西他赛（docetaxel），埃坡霉素（epothilones）等，它们主要促进微管的聚集；另一类则主要抑制微管的聚集，而这一类根据与微管结合位点的不同，也可以分为秋水仙碱类和长春碱类，前者包括秋水仙碱（colchicine），秋水仙胺（colcemid），combretastatin A4（CA4）等，后者包括长春质碱（vinblastine），长春新碱（vincristine）及长春瑞滨（vinorelbine）等。

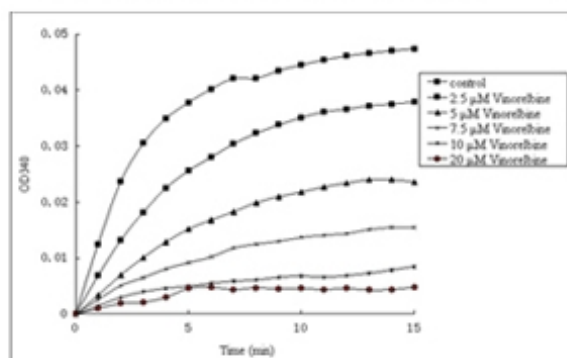
【筛选项目】

Anti-tubulin Drug Assays

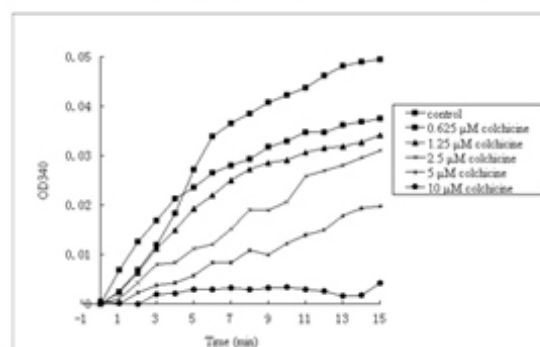
Tubulin polymerization and depolymerization

【结果示例】

不同浓度的长春瑞滨抑制微管蛋白的聚集



不同浓度的秋水仙碱抑制微管蛋白的聚集



1. 12. 蛋白酶体 (Proteasome 26S) 抑制剂筛选

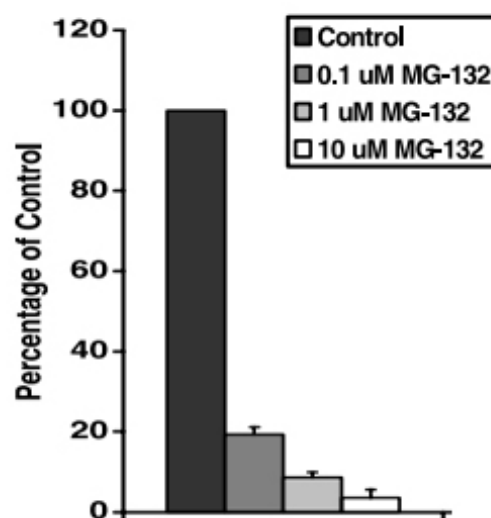
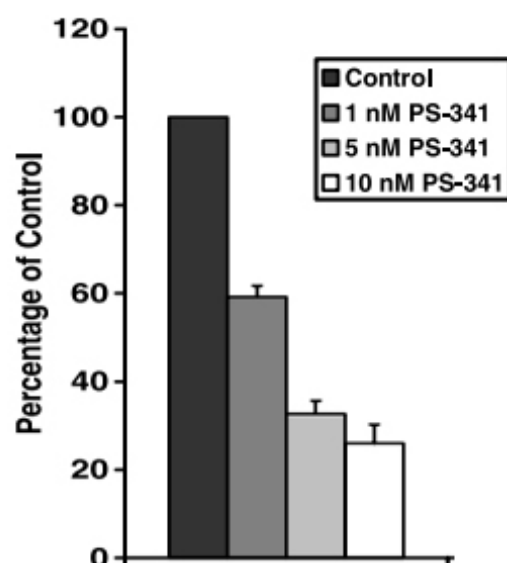
【生物背景】

蛋白酶体位于细胞核和细胞质中，蛋白酶体的主要作用是降解细胞不需要的或受到损伤的蛋白质。蛋白酶体抑制剂对于人工培养的细胞具有有效的抗肿瘤活性，通过降解受调控的促生长细胞周期蛋白来诱导肿瘤细胞的凋亡。这种可以选择性地诱导肿瘤细胞凋亡的方法被证明在动物模型以及人体试验中都非常有效。硼替佐米是第一种用作化学治疗药物的蛋白酶体抑制剂，主要被用于多发性骨髓瘤的治疗。

【筛选项目】

Proteasome Assays
Proteasome 26S

【结果示例】



1. 13. 多药耐药 (MDR) 相关的P糖蛋白抑制剂

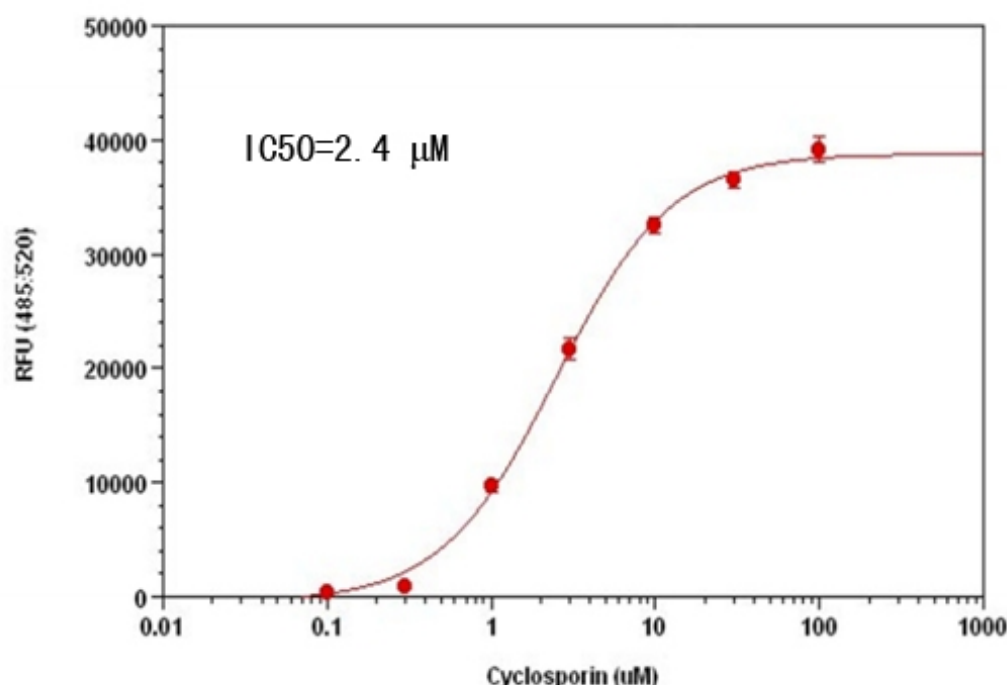
【生物背景】

多药耐药 (MDR) 是细胞在许多环节发生变化引起的，其中在减少药物进入细胞方面，一方面是减少细胞膜上被动转运子的数量，另一方面是增加外排药泵蛋白的表达，这些外排药泵蛋白可以把许多类型的药物分子逆浓度梯度排至胞外。一个最主要的药泵蛋白就是P-糖蛋白，这种蛋白在许多类型的肿瘤细胞中均有表达，而且与较差的化疗疗效、较差的愈后均相关。

【筛选项目】

MDR Assays
P糖蛋白

【结果示例】



1.14. 拓扑异构酶抑制剂筛选

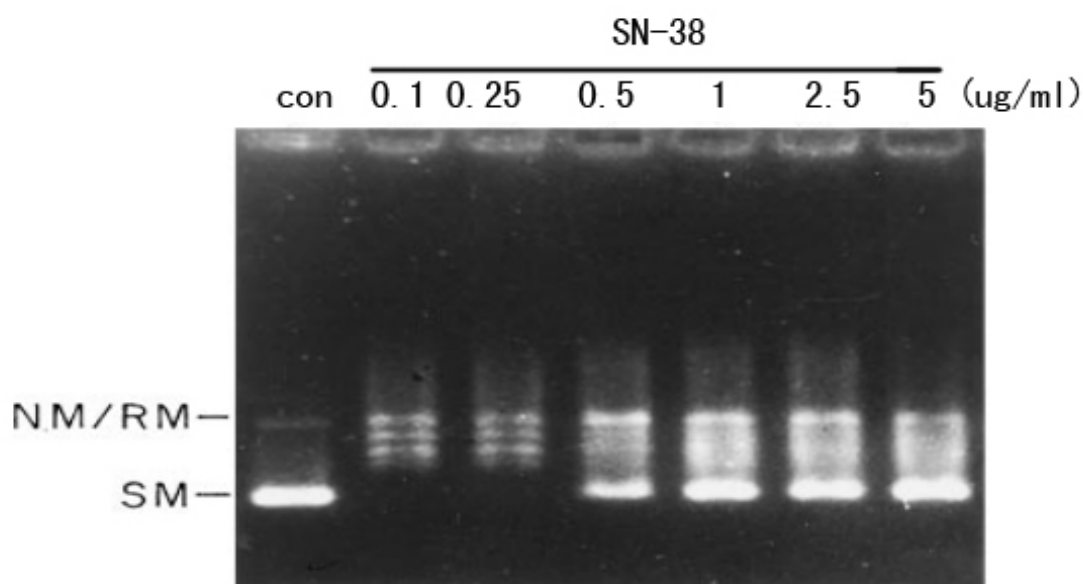
【生物背景】

DNA拓扑异构酶是存在于细胞核内的一类酶，他们能够催化DNA链的断裂和结合，从而控制DNA的拓扑状态，拓扑异构酶参与了超螺旋结构模板的调节。主要存在两种哺乳动物拓扑异构酶，即I型及II型拓扑异构酶。I型DNA拓扑异构酶对单链DNA的亲合力要比双链高得多，这正是它识别负超螺旋DNA的分子基础，因为负超螺旋DNA常常会有一定程度的单链区。负超螺旋越高，DNA拓扑异构酶I作用越快。

【筛选项目】

Topoisomerase Assays
topoisomerase I, topoisomerase II

【结果示例】



超低价格 震撼来袭

1. 筛选价格低：检测一个化合物酶水平IC₅₀值仅需990元；
2. 筛选质量高：实验数据重复性好，内参阳性药与文献数据相同；
3. 筛选速度快：两至三周出报告；
4. 筛选项目全：192种热门靶点；
5. 筛选保密性强：签署保密协议；
6. 先筛选后付费：客户对实验结果不满意，保证全额退款；
7. 已经为中科院上海药物研究所、上海交大药学院、上海医工所等院校的众多老师提供了筛选服务；

测一个IC₅₀值

990元

请拨打：15821697315

上海唐尧生物科技有限公司
Shanghai TANG Bioscience Co. Ltd.

地址：上海市闵行区华宁路200号2幢3楼

电话：15821697315 400-018-0036

传真：021-64828900

电子邮箱：service@tangbioscience.com.cn

网址：www.tangbioscience.com.cn

2. 抗糖尿病新药酶水平筛选

2. 1. 二肽基肽酶（DPP）抑制剂筛选

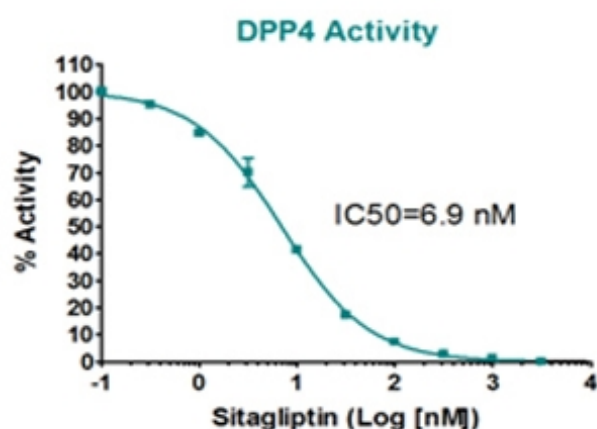
【生物背景】

二肽基肽酶是一种丝氨酸蛋白酶, 能迅速裂解和失活肠促胰岛素, 神经肽和细胞因子。使用二肽基肽酶抑制剂能够增强这些物质的内源性生物活性, 肠促胰岛素和神经肽的活性增强能够降低空腹和餐后葡萄糖浓度及糖化血红蛋白水平, 改善胰岛素敏感性和 β 细胞功能。二肽基肽酶4抑制剂具有良好的抗糖尿病作用。

【筛选项目】

DPP Assays		
DPP3	DPP8	FAP
DPP4	DPP9	POP
DPP7		

【结果示例】



2.2. 去乙酰化酶（Sirtuin）抑制剂筛选

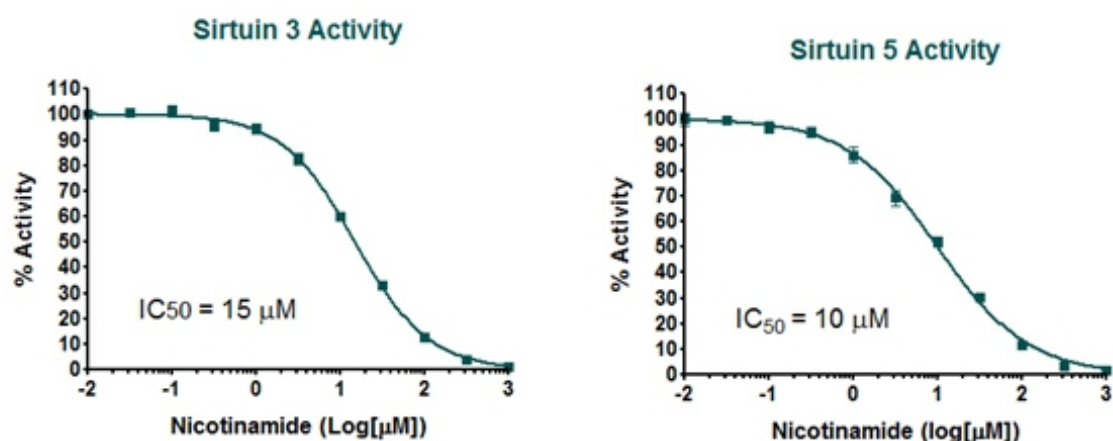
【生物背景】

Sirtuin是一类功能多样的去乙酰化酶，其成员的生物学功能不尽相同，分别参与调节衰老及各种疾病的能量代谢及应激反应，因此成员都存在潜在靶标用以治疗糖尿病等代谢性疾病及衰老相关疾病的研究。对其进一步深入研究不仅将有可能提供更多有关细胞生命过程调控的信息还可为临床疾病的诊断及治疗提供依据。

【筛选项目】

DPP Assays		
Sirtuin1 Sirtuin2	Sirtuin3 Sirtuin5	Sirtuin6

【结果示例】



2.3. 过氧化物酶体增殖活性受体 (PPAR) 激动剂筛选

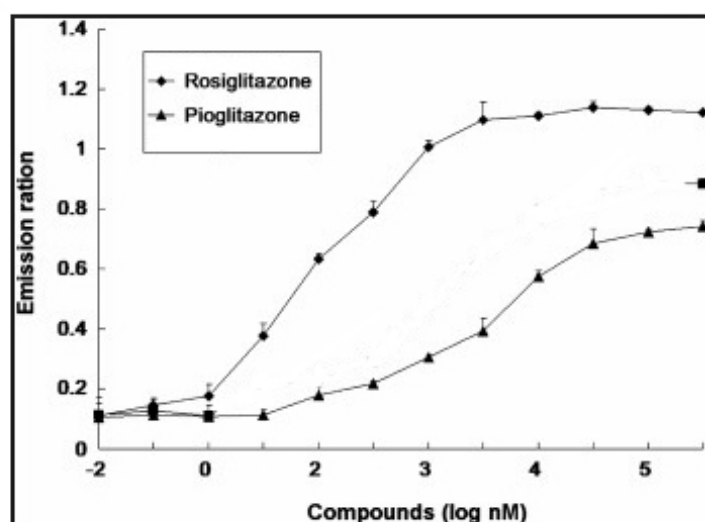
【生物背景】

过氧化物酶体增殖物活化受体 (PPAR) 是控制环境与饮食刺激的关键调节物。其中 α 受体主要参与肝细胞的氧化过程, β/δ 受体则参与了脂肪细胞的分解过程, γ 受体与脂肪细胞的生成过程有关, 这两个受体被认为与肥胖有关。本类受体只有同视黄醇类X受体 (RXR) 结合后才会发生作用。

【筛选项目】

PPAR Assays
PPAR α , PPAR β/δ , PPAR γ ;

【结果示例】



2.4. 其他与代谢相关的酶抑制剂筛选

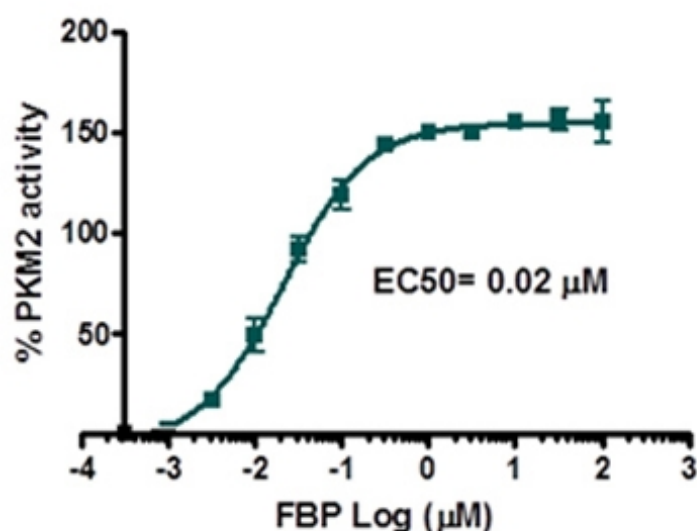
【生物背景】

糖、蛋白质、脂肪及水、矿物质等代谢障碍，常常是相互影响和联系的，有时会造成恶性循环。如胰岛素缺乏使血糖升高，血浆脂蛋白、胆固醇、甘油三酯升高，蛋白质分解，负氮平衡，糖的渗透性利尿造成脱水及钾、钠、钙、磷、镁等负平衡，严重者发生酮症酸中毒，后者又加重血糖及血脂的升高，如此循环，直至病人死亡。

【筛选项目】

Metabolic Enzyme Assays			
Amylase	Amylase	IDH1	Isocitrate Dehydrogenase 1
ACC1	Acetyl Coenzyme A carboxylase 1	IDH2	Isocitrate Dehydrogenase 2
ACC2	Acetyl Coenzyme A carboxylase 2	Lipase	Lipase
ALOX-15	Arachidonate 15-lipoxygenase	MTAP	Methylthioadenosine phosphorylase
ACLY	ATP Citrate Lyase	NAMPT	Nicotinamide phosphoribosyltransferase
CA1	Carbonic Anhydrase 1	NMNAT	Nicotinamide nucleotide adenylyltransferase 1
CA2	Carbonic Anhydrase 2	PKL	Pyruvate kinase, Liver
FUK	Fucokinase	PKR	Pyruvate kinase, RBC
FDH	Formaldehyde dehydrogenase	PKM1	Pyruvate kinase M1
GK1	Galactokinase	PKM2	Pyruvate kinase M2

【结果示例】



超低价格 震撼来袭

1. 筛选价格低：检测一个化合物酶水平IC₅₀值仅需990元；
2. 筛选质量高：实验数据重复性好，内参阳性药与文献数据相同；
3. 筛选速度快：两至三周出报告；
4. 筛选项目全：192种热门靶点；
5. 筛选保密性强：签署保密协议；
6. 先筛选后付费：客户对实验结果不满意，保证全额退款；
7. 已经为中科院上海药物研究所、上海交大药学院、上海医工所等院校的众多老师提供了筛选服务；

测一个IC₅₀值

990元

请拨打：15821697315

上海唐尧生物科技有限公司
Shanghai TANG Bioscience Co. Ltd.

地址：上海市闵行区华宁路200号2幢3楼

电话：15821697315 400-018-0036

传真：021-64828900

电子邮箱：service@tangbioscience.com.cn

网址：www.tangbioscience.com.cn

3. 其他靶点酶水平新药筛选服务

3.1. 磷酸二酯酶（PDE）抑制剂筛选

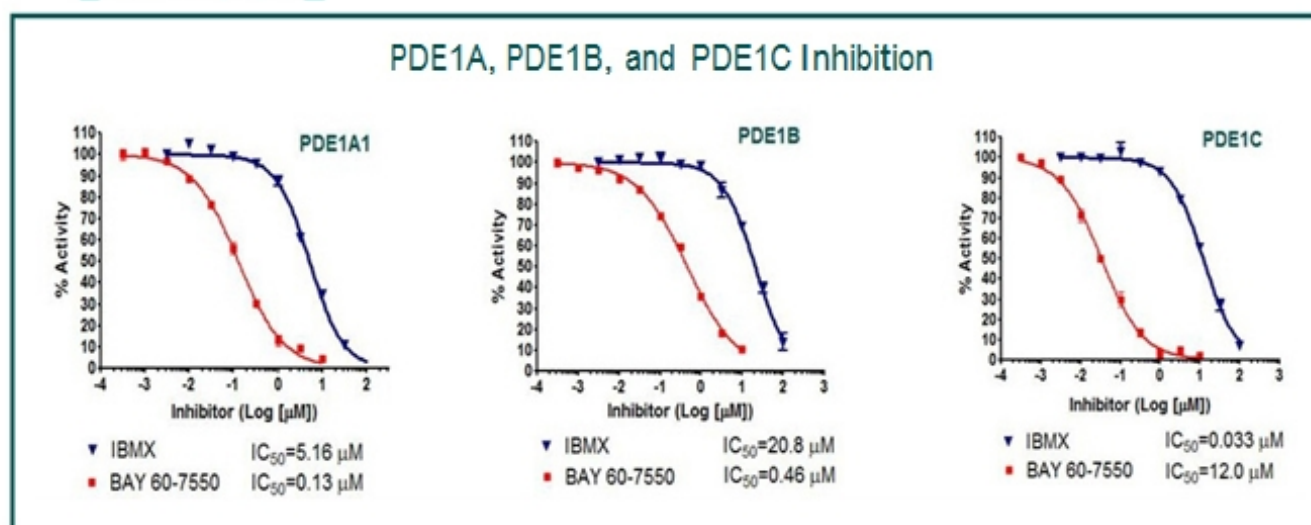
【生物背景】

磷酸二酯酶（PDEs）具有水解细胞内第二信使（cAMP, 环磷酸腺苷或cGMP, 环磷酸鸟苷）的功能，降解细胞内cAMP或cGMP，从而终结这些第二信使所传导的生化作用。cAMP和cGMP对于细胞活动起着重要的调节作用。而其浓度的调节主要由核苷酸环化酶的合成和磷酸二酯酶(PDEs)水解作用之间的平衡决定。PDEs在人体内分布广泛，生理作用涉及多个研究领域。近年来，PDEs作为新的治疗靶点，引起了众多学者广泛的关注，成为一个新的研究热点，选择性PDE 4和PDE 5抑制剂的临床研究受到格外的重视。

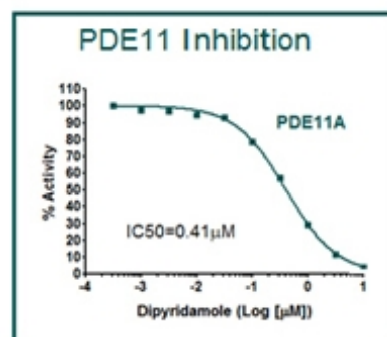
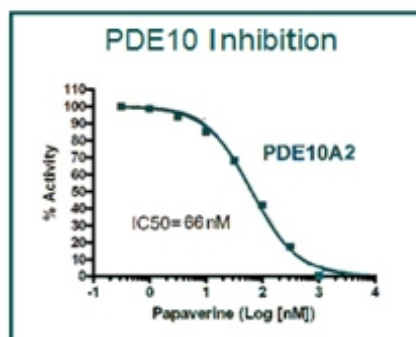
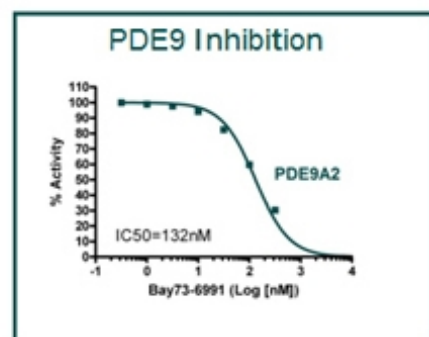
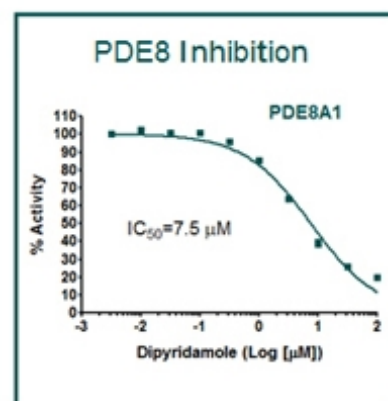
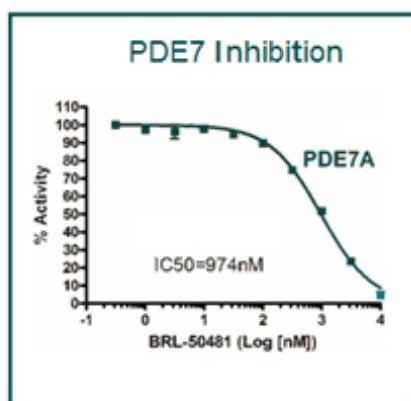
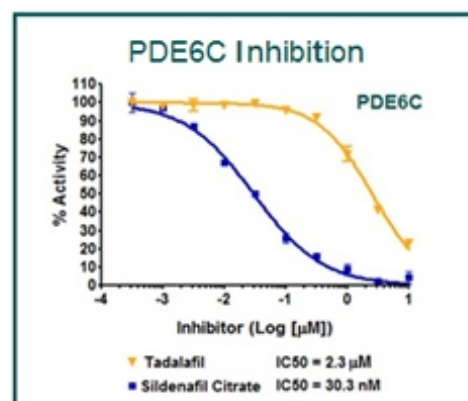
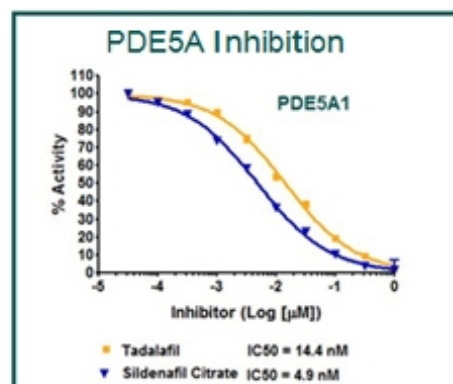
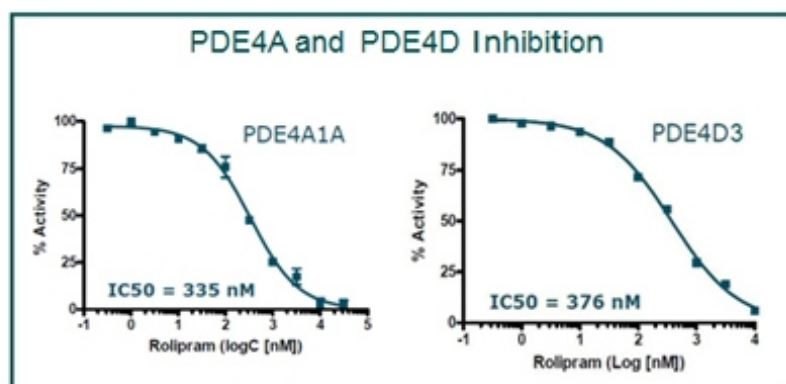
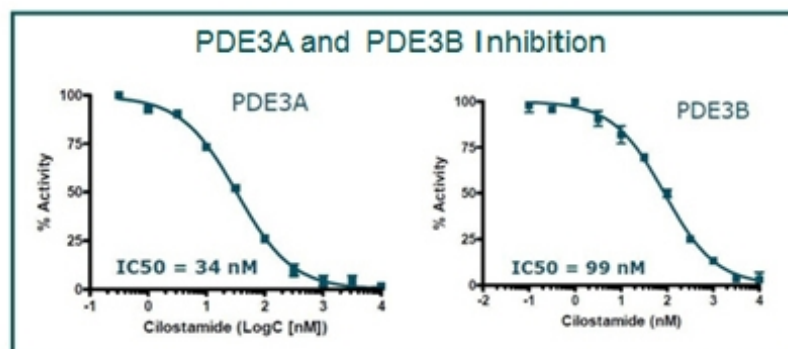
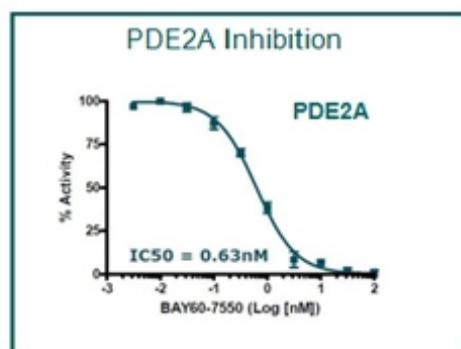
【筛选项目】

PDE Assays		
PDE1A	PDE4A4B	PDE6C
PDE1B	PDE4B1	PDE7A
PDE1C	PDE4B2	PDE7B
PDE2A1	PDE4C1	PDE8A1
PDE3A	PDE4D2	PDE9A2
PDE3B	PDE4D3	PDE10A1
PDE4A10	PDE4D7	PDE10A2
PDE4A1A	PDE5A	PDE11A

【结果示例】



【结果示例】



3.2. 磷脂酶A2 (PLA2) 抑制剂筛选

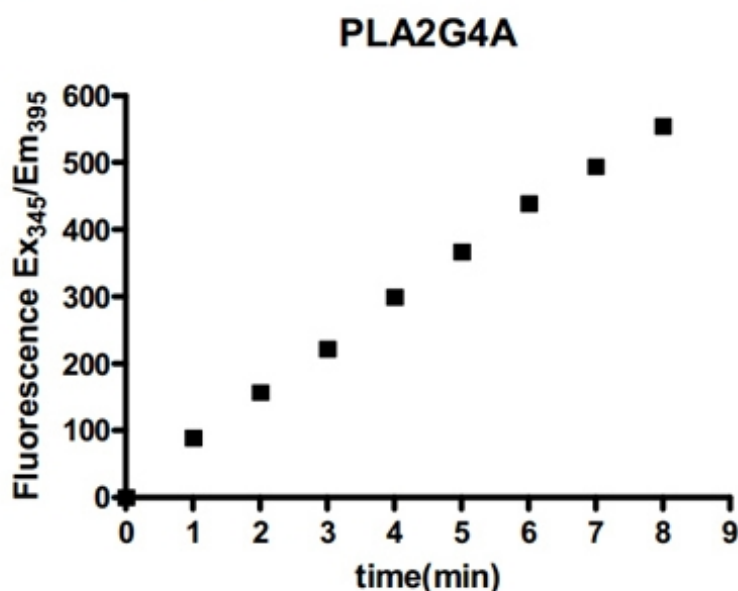
【生物背景】

磷脂酶A2 (phospholipaseA2 PLA2) 是一种能催化磷脂甘油分子上二位酰基的水解酶，亦是花生四烯酸(AA)、前列腺素及血小板活化因子(PAF)等生物活性物质生成的限速酶，所产生的脂质介质在炎症和组织损伤时膜通道的活化、信息传递、血流动力学及病理生理过程中，以及在调节细胞内外代谢中起关键性作用。

【筛选项目】

PDE Assays		
PLA2 G12A PLA2 G12B	PLA2 G4A	PLA2 G7

【结果示例】



3.3. 前蛋白转化酶枯草溶菌素9 (PCSK9) 抑制剂筛选

【生物背景】

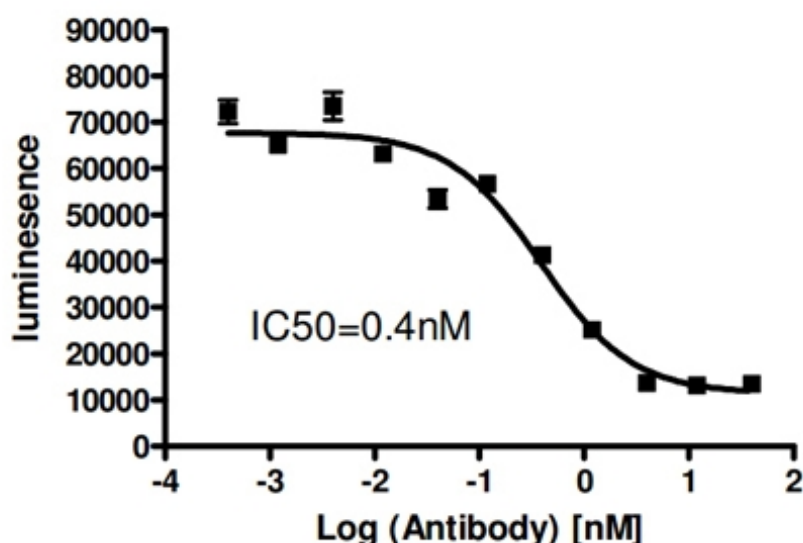
前蛋白转化酶枯草溶菌素9通过与LDLR的结合，影响胆固醇水平，但其作用底物尚未确定，其与LDLR的作用方式也有待进一步的研究，而PCSK9对极低密度脂蛋白代谢的影响还存在争论。PCSK9基因的不同突变通过改变分泌蛋白的活性，对血胆固醇代谢产生显著影响，PCSK9突变可影响血浆胆固醇水平，是一个很有前途的高胆固醇血症的治疗靶点。

【筛选项目】

PCSK9	Assays
	PCSK9

【结果示例】

Inhibition of PCSK9[B]-LDLR by Anti-PCSK9



3. 4. 抗病毒药物筛选

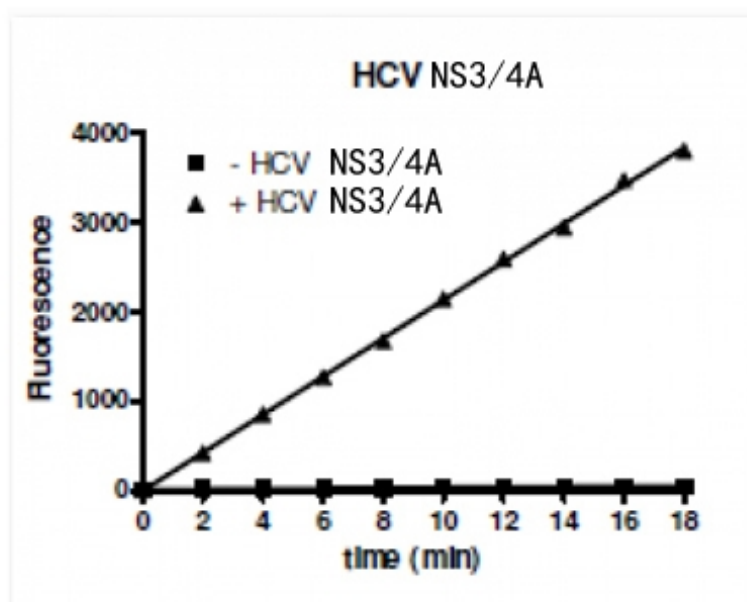
【生物背景】

丙肝病毒HCV的蛋白酶NS3、NS4A与一些宿主蛋白和脂类构成复制复合体，并且对肝癌细胞中HCV基因的自主复制尤为关键。NS3 具有RNA解旋酶和蛋白酶活性。RNA解旋酶对于RNA复制是必需的，而蛋白酶对下游区非结构蛋白加工是必需的。NS4A促进NS3 固定在内质网膜上并支持其蛋白酶活性。轮状病毒HRV可以引起胃肠炎，HRV3C蛋白酶可以将前体多聚蛋白裂解成11个终末产物，3C蛋白酶在HRV病毒的复制过程中具有不可替代的作用。

【筛选项目】

Virus Protease Assays	
HCV NS3/4A	Protease, HRV3C Protease, H1N1 Neuraminidase, HIV Integrase

【结果示例】



3.5. 抗凝血药物筛选

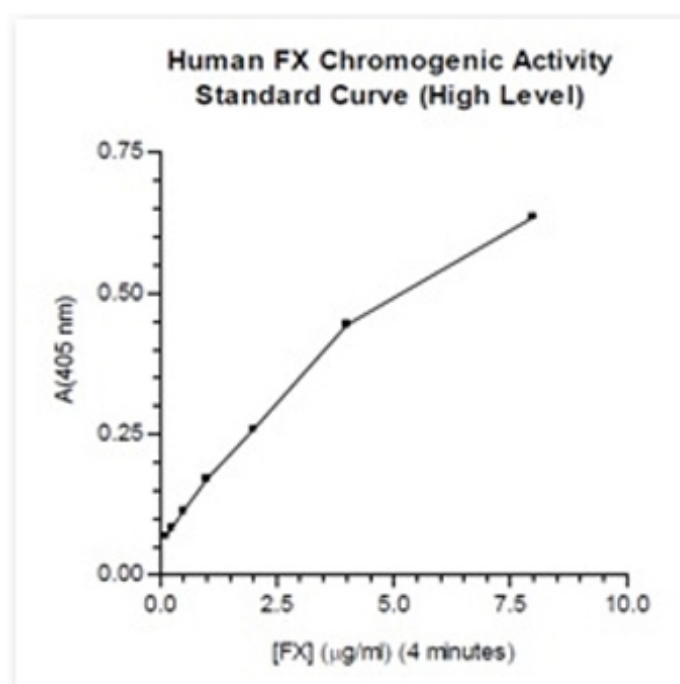
【生物背景】

血液凝固是一系列复杂的化学连锁反应过程，参与各链锁反应的多种物质组成的系统称为凝血系统。其化学本质，除钙离子外，其余成分绝大多数为蛋白质，正常情况下，都以无活性的形式存在于血浆中。凝血酶原激活物的形成，依其形成途径，分为内源性凝血系统和外源性凝血系统。

【筛选项目】

Blood Coagulation Factor Assays		
Factor Xa	Factor XIV	Thrombin

【结果示例】



3. 6. 抗高血压药物筛选

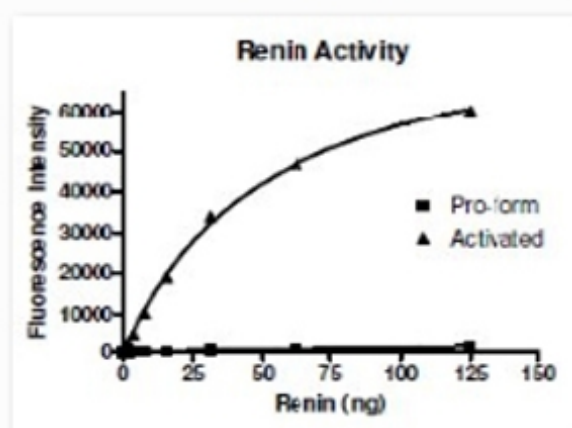
【生物背景】

过度激活的肾素-血管紧张素-醛固酮系统是产生高血压的原因之一。下面几类药物可用于抑制肾素-血管紧张素系统：1. 血管紧张素转化酶抑制剂（ACEI），其作用是抑制血管紧张素转换酶（ACE）的活性，从而减少血管紧张素II的生成，如卡托普利。2. 血管紧张素II受体拮抗剂，通过阻断血管紧张素II与AT1受体结合而起作用，如沙坦类药物。3. 肾素抑制剂，通过抑制肾素的合成和释放，从而阻止RAS的启动。

【筛选项目】

Renin-angiotensinsystem Assays
Renin, Angiotensinase

【结果示例】



3.7. 溴结构域 (BRD) 蛋白抑制剂筛选

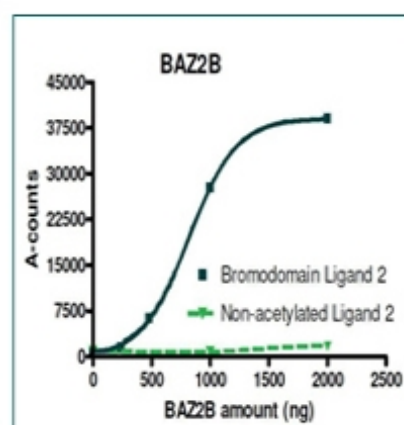
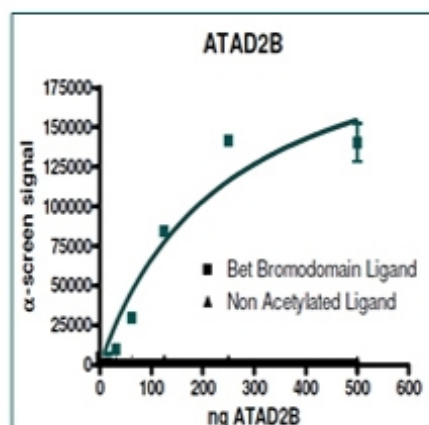
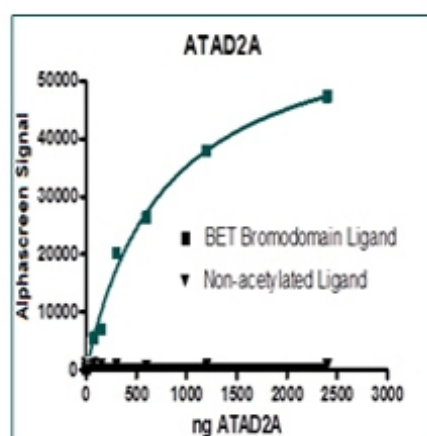
【生物背景】

溴结构域1992年首次被发现，大约包含110 个氨基酸，含溴结构域蛋白通常包含酶结构域（如HATs）或其它结构域（如PHDs），这种多个结构域的存在有助于被特异性化合物或药物识别。近来有研究报道了包含串联溴结构域的转录调节因子家族（BET蛋白）的选择性抑制剂JQ1 和IBET，此类抑制剂具有较高的亲和力、特异性和细胞渗透性。这些抑制剂在治疗几种癌症和系统性炎症疾病中的作用已经得到实验证实。

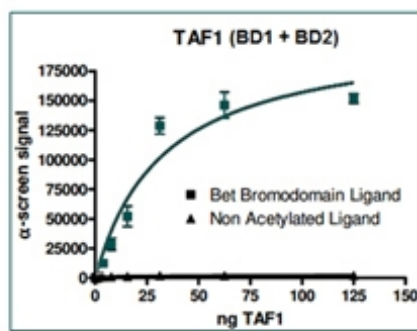
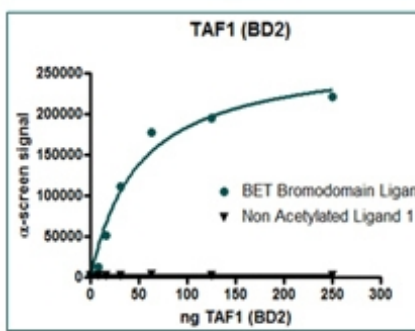
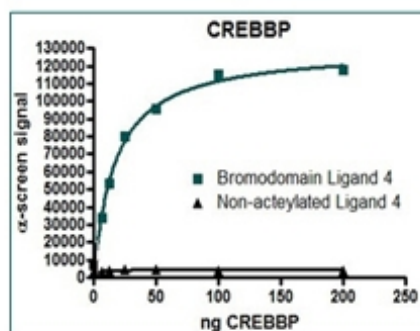
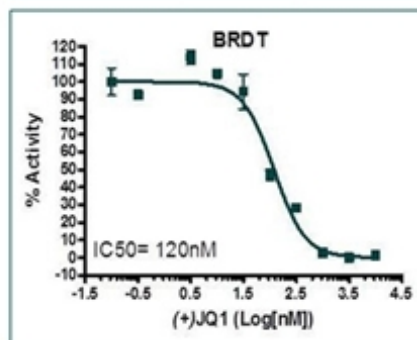
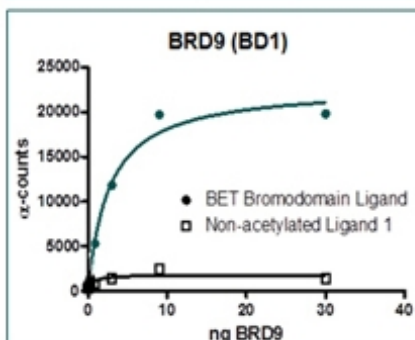
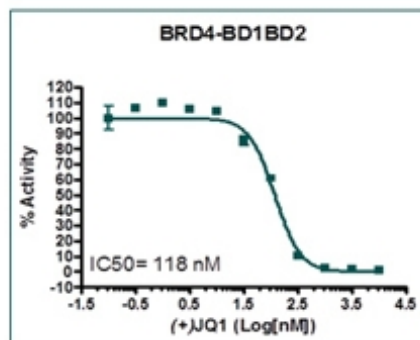
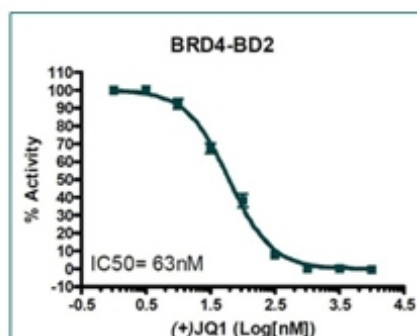
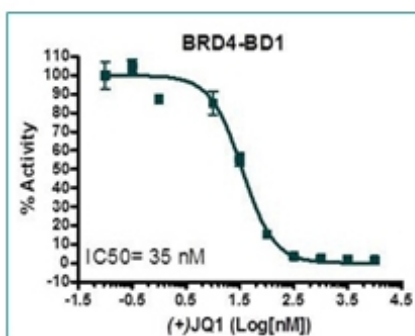
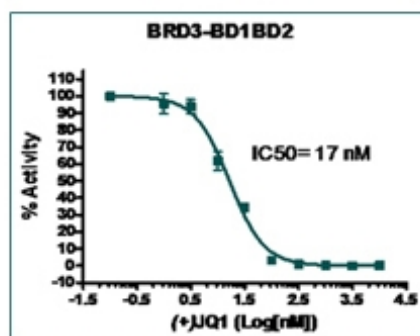
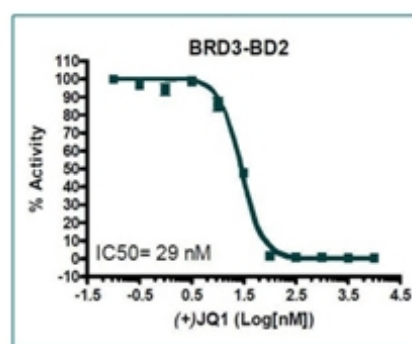
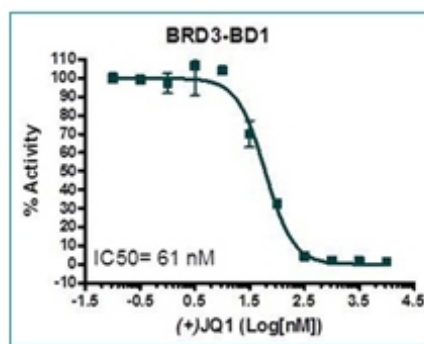
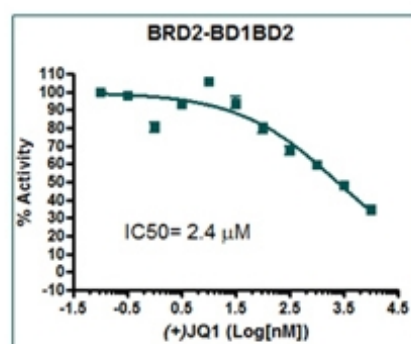
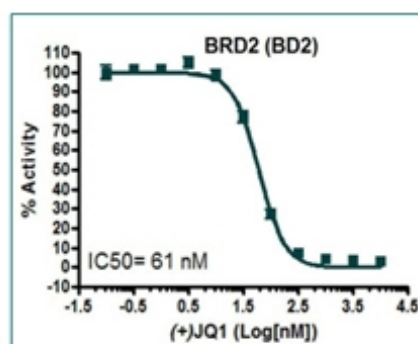
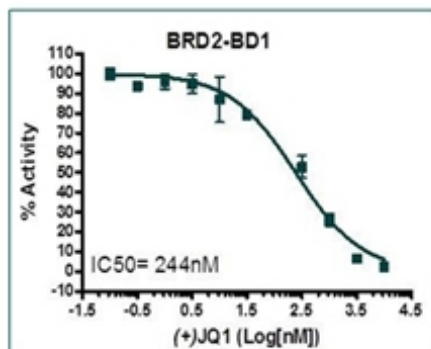
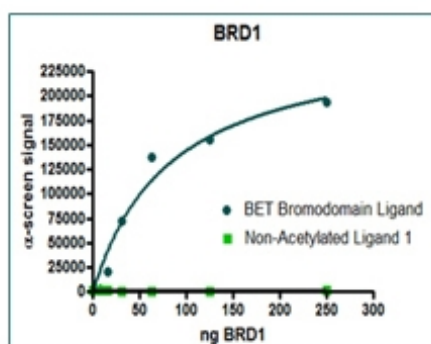
【筛选项目】

Bromodomain Assays			
ATAD2A	BRD2 (BD1 + BD2)	BRD4 (BD2)	TAF1 (BD2)
ATAD2B	BRD3 (BD1)	BRD4 (BD1 + BD2)	TAF1 (BD1 + BD2)
BAZ2B	BRD3 (BD2)	BRD9 (BD1)	TAF1L (BD2)
BRD1	BRD3 (BD1 + BD2)	BRDT (BD1)	TAF1L (BD1 + BD2)
BRD2 (BD1)	BRD4 (BD1)	BRPF3	TRIM24 (TIF1)
BRD2 (BD2)		CREBBP	

【结果示例】



【结果示例】



3. 8. 组织蛋白酶相关药物筛选

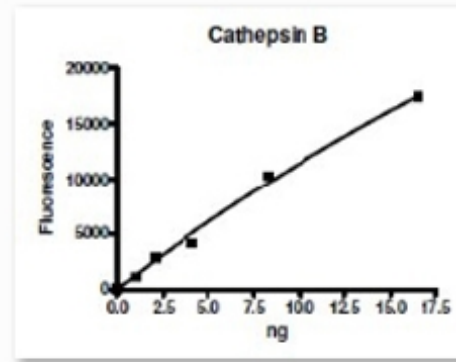
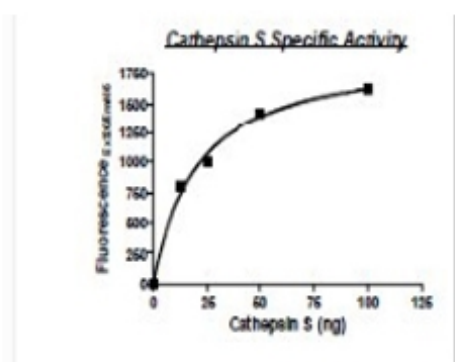
【生物背景】

组织蛋白酶是半胱氨酸蛋白酶家族的主要成员，在生物界已发现20余种，人体中主要存在11种，它们与人类肿瘤、骨质疏松、关节炎等多种重大疾病密切相关。Medivir 公司，已经投入了大量的资金用于Cat2S抑制剂（抗类风湿性关节炎和多发性硬化等自身免疫性疾病）和Cat2K抑制剂（抗骨质疏松）的研究；Medivir 还与Peptimmune公司（专门研究自身免疫性疾病及过敏性疾病的生物技术公司）联合，专门开发组织蛋白酶S的小分子抑制剂；目前已报道用于骨质疏松症治疗的一种组织蛋白酶K的抑制剂SB2462795已经进入临床研究。

【筛选项目】

Cathepsin Assays		
Cathepsin B Cathepsin F	Cathepsin L Cathepsin S	Cathepsin V

【结果示例】



3.9. 凋亡相关药物筛选

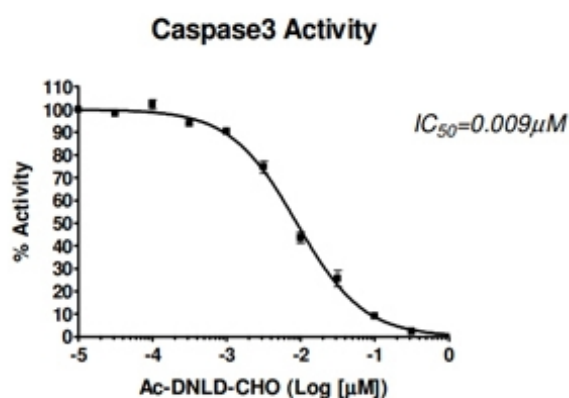
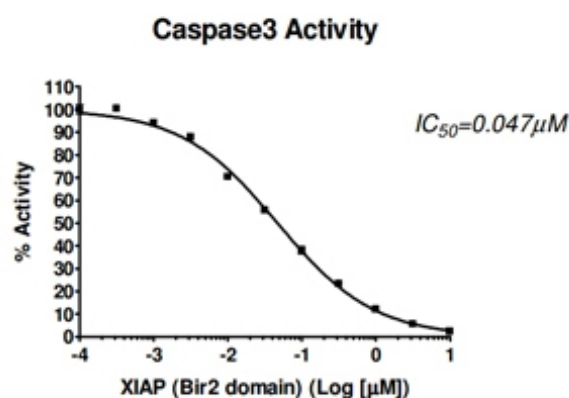
【生物背景】

Caspase全称为含半胱氨酸的天冬氨酸蛋白水解酶(cysteinyI aspartate specific proteinase), Caspase是一组存在于细胞质中具有类似结构的蛋白酶。Caspase与真核细胞凋亡密切相关, 并参与细胞的生长、分化与凋亡调节。它们的活性位点均包含半胱氨酸残基, 能够特异性的切割靶蛋白天冬氨酸残基上的肽键名。Caspase负责选择性地切割某些蛋白质, 从而造成细胞凋亡。

【筛选项目】

Caspase Assays		
Caspase 3 Caspase 6	Caspase 7	Caspase 8

【结果示例】



3. 10. 泛素相关药物筛选

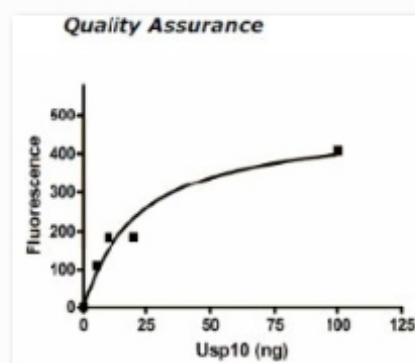
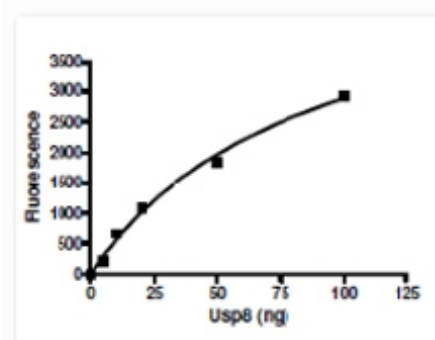
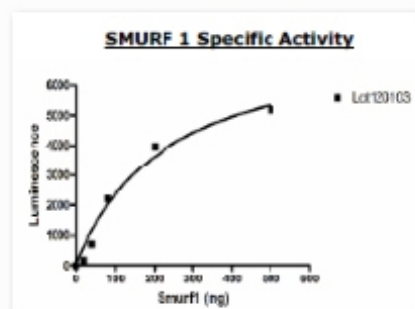
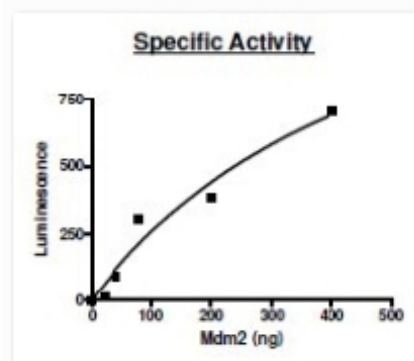
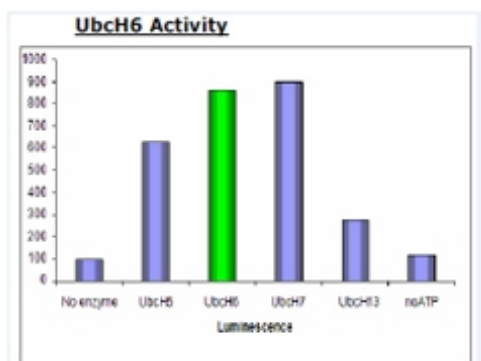
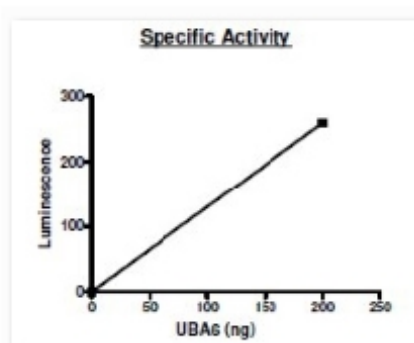
【生物背景】

泛素化信号通路。在第一步反应中，泛素活化酶（又被称为E1）水解ATP并将一个泛素分子腺苷酸化。接着，泛素被转移到E1的活性中心的半胱氨酸残基上，并伴随着第二个泛素分子的腺苷酸化。被腺苷酸化的泛素分子接着被转移到第二个酶，泛素交联酶（E2）的半胱氨酸残基上。最后，高度保守的泛素连接酶（E3）家族中的一员（根据底物蛋白质的不同而不同）识别特定的需要被泛素化的靶蛋白，并催化泛素分子从E2上转移到靶蛋白上。靶蛋白在被蛋白酶体识别之前，必须被标记上至少四个泛素单体分子（以多泛素链的形式）。因此，是E3使得这一系统具有了底物特异性。E1、E2和E3蛋白的数量依赖于生物体和细胞类型，人体中就存在大量不同的E3蛋白，这说明泛素-蛋白酶体系统可以作用于数量巨大的靶蛋白。最终，被标记的蛋白质被蛋白酶分解为较小的多肽、氨基酸以及可以重复使用的泛素。

【筛选项目】

Ubiquitin Assays			
泛素活化酶(E1) UBA6 (UBE1L2) UBE1	泛素交联酶(E2) UbcH13 (UBE2N) UbcH5a UbcH6 (UBE2E1) UbcH7 (UBE2L3) 9UEV1A (UBE2V1)	泛素连接酶 (E3) Mdm2 (Hdm2) 11 MYLIP/IDOL Nedd4 RNF20 SMURF1 SMURF2 UBE3A UHRF1 (2-793) WWP1	去泛素化酶 A20 (TNFAIP3) Ataxin-3 OTUD6B UCHL1 UCHL3 USP10 USP14 USP2 USP2 USP5(IsoT) USP7 USP8

【结果示例】



超低价格 震撼来袭

1. 筛选价格低：检测一个化合物酶水平IC₅₀值仅需990元；
2. 筛选质量高：实验数据重复性好，内参阳性药与文献数据相同；
3. 筛选速度快：两至三周出报告；
4. 筛选项目全：192种热门靶点；
5. 筛选保密性强：签署保密协议；
6. 先筛选后付费：客户对实验结果不满意，保证全额退款；
7. 已经为中科院上海药物研究所、上海交大药学院、上海医工所等院校的众多老师提供了筛选服务；

测一个IC₅₀值

990元

请拨打：15821697315

上海唐尧生物科技有限公司
Shanghai TANG Bioscience Co. Ltd.

地址：上海市闵行区华宁路200号2幢3楼

电话：15821697315 400-018-0036

传真：021-64828900

电子邮箱：service@tangbioscience.com.cn

网址：www.tangbioscience.com.cn