

# MAPK / ERK pathway

MAPK/ERK通路, 又称Ras-Raf-MEK-ERK通路, 是一种从细胞表面受体传递信号到细胞核的信号级联。它涉及一系列启动和调节通路活性的蛋白质。

当信号分子与细胞表面的受体结合时, 将激活Ras蛋白质, 从而引发一系列的激酶活化, 首先是MAP3K (如Raf), 然后是MAP2K, 最终导致MAPK (丝裂原激活蛋白激酶) 的活化。MAPK随后磷酸化下游靶点, 包括Myc等转录因子。

该通路中蛋白质的突变可能会破坏其正常功能, 导致异常活化或失活。这种失调在各种癌症中常见。因此, MAPK/ERK通路成为癌症研究的焦点, 科研人员努力致力于开发能够调控其“on / off”状态的药物。

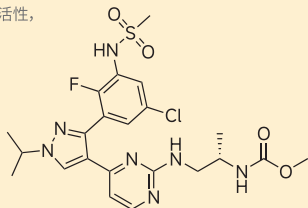
- RAF
- MEK
- p38 MAPK
- ERK
- JNK
- KLF
- TAOK
- RSK
- MAP4K4
- MK2
- MNK
- HPK1
- MLK

# MAPK / ERK pathway

## RAF

### Encorafenib

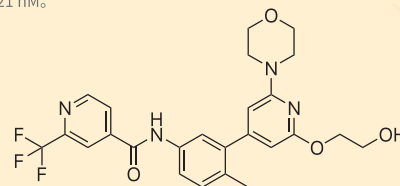
Encorafenib (LGX818) 是一种高效的 BRAF 抑制剂, 对 BRAFV600E 细胞有选择性抗增殖和促凋亡活性, IC50 值为 4 nM。



A312190 | 98%  
1269440-17-6

### LXH254

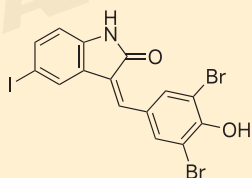
LXH254 是一种有效的、具有口服活性的 II 型 BRAF 和 CRAF 抑制剂, 对 CRAF 和 BRAF 的 IC50 值分别为 0.072 和 0.21 nM。



A344788 | 97%  
1800398-38-2

### GW 5074

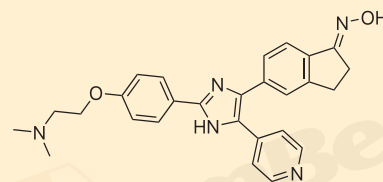
GW 5074 是一种有效的, 选择性的 c-Raf 抑制剂, IC50 值为 9 nM; 对 JNK1/2/3, MEK1, MKK6/7, CDK1/2, c-Src, p38 MAP, VEGFR2 或 c-Fms 等没有作用。



A471753 | 98%  
220904-83-6

### SB-590885

SB-590885 是一种有效的 B-Raf 抑制剂, Ki 值为 0.16 nM; 对其选择性是对 c-Raf 的 11 倍多。

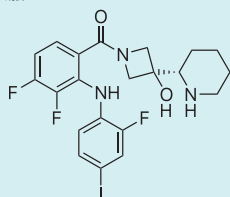


A720977 | 98%  
405554-55-4

## MEK

### Cobimetinib

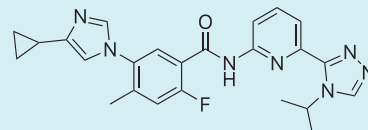
Cobimetinib (GDC-0973, RG7420) 是有效, 选择性, 可口服的 MEK1 抑制剂, 抑制 MEK1 的 IC50 为 4.2 nM。



A181766 | 98%  
934660-93-2

### Selonsertib

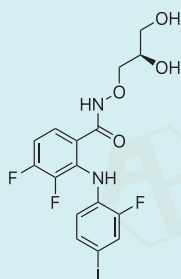
Selonsertib (GS-4997) 是一种选择性的, 具有生物口服可利用的凋亡信号调节激酶 1 (ASK1) 抑制剂, pIC50 为 8.3。



A156190 | 97%  
1448428-04-3

### Mirdametinib

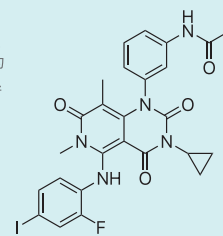
Mirdametinib (PD0325901) 是一种具有口服活性, 选择性和非 ATP 竞争性的 MEK 抑制剂, IC50 为 0.33 nM。Mirdametinib 对活化的 MEK1 和 MEK2 的 Kiapp 值为 1 nM。Mirdametinib 抑制 p-ERK1/2 的表达并诱导细胞凋亡 (apoptosis)。Mirdametinib 对多种人类肿瘤异种移植植物具有抗癌活性。



A370482 | 98%  
391210-10-9

### Trametinib

Trametinib (GSK1120212; JTP-74057) 是口服有效的 MEK 抑制剂, 抑制 MEK1 和 MEK2 的 IC50 分别为 2 nM。Trametinib 可以激活自噬 (autophagy), 诱导凋亡 (apoptosis)。

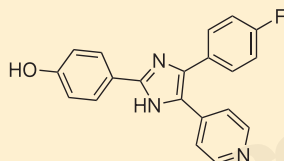


A188937 | 98%  
871700-17-3

## p38 MAPK

### SB 202190

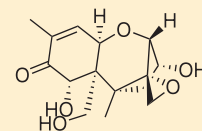
SB 202190 是选择性的 p38 MAPK 抑制剂, 抑制 p38α 和 p38β 的 IC50 分别为 50 nM 和 100 nM。SB 202190 与重组人活性 p38 激酶的 ATP 袋结合, Kd 值为 38 nM。SB 202190 具有抗癌活性并可以挽救记忆障碍。



A277214 | 98%  
152121-30-7

### Deoxyvalenolol

Deoxyvalenolol, 是一种单端孢菌素家族 (trichothecenes family) 的真菌毒素, 通过紧密连接处的细胞旁路来穿过肠粘膜。Deoxyvalenolol 转运不受 P-糖蛋白 (PgP) 或多药耐药相关蛋白 (MRP) 抑制剂的影响。

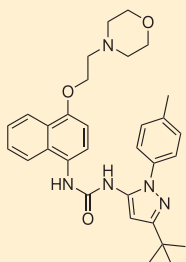


A411475 | 97%  
51481-10-8

## p38 MAPK

### Doramapimod

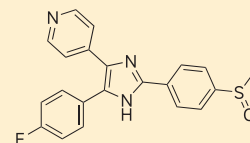
Doramapimod (BIRB 796) 是一种具有口服活性的, 高效的 p38 MAPK 抑制剂, IC50 值分别为 p38 $\alpha$ =38 nM, p38 $\beta$ =65 nM, p38 $\gamma$ =200 nM, p38 $\delta$ =520 nM。Doramapimod 对 p38 激酶具有皮摩尔亲和力 (Kd=0.1 nM)。Doramapimod 也抑制 B-Raf 和 Abl, IC50 分别为 83 nM 和 14.6  $\mu$ M。



A103377 | 99%  
285983-48-4

### Adezmapimod

Adezmapimod (SB 203580) 是一种选择性的, ATP 竞争性的 p38 MAPK 抑制剂, 对 SAPK2a/p38 和 SAPK2b/p38 $\beta$ 2 的 IC50 分别为 50 nM 和 500 nM。Adezmapimod 抑制 LCK, GSK3 $\beta$  和 PKB $\alpha$ , IC50 比 SAPK2a/p38 高 100-500 倍。Adezmapimod 不抑制 JNK 活性, 是一种自噬 (autophagy) 和线粒体自噬 (mitophagy) 激活剂。

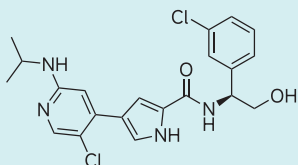


A248150 | 98%  
152121-47-6

## ERK

### Ulixertinib

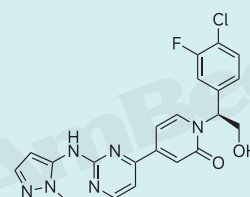
Ulixertinib (BVD-523; VRT752271) 是一种有效、可口服、高度选择性、ATP-竞争性、可逆、共价的 ERK1/2 抑制剂, 对 ERK2 的 IC50 值 <0.3 nM。Ulixertinib (BVD-523; VRT752271) 可抑制 ERK2 和下游蛋白 RSK 的磷酸化。



A162263 | 99%  
869886-67-9

### Ravoxertinib

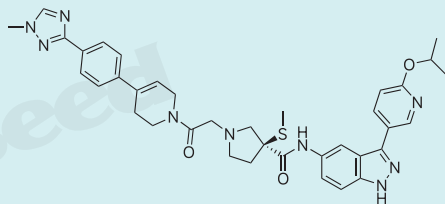
Ravoxertinib (GDC-0994) 是具有口服活性的 ERK 激酶抑制剂, 抑制 ERK1 和 ERK2 的 IC50 分别为 6.1 nM 和 3.1 nM。



A170354 | 98%  
1453848-26-4

### MK-8353

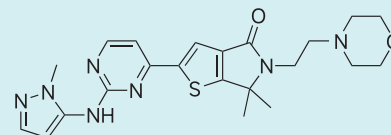
MK-8353 (SCH900353) 是一种有效的, 选择性的, 可口服的 ERK1/2 抑制剂, IC50 值分别为 23.0 nM 和 8.8 nM; MK-8353 具有抗肿瘤活性。



A480964 | 98%  
1184173-73-6

### Temuterkib

Temuterkib (LY3214996) 是高效的选择性 ERK1 和 ERK2 抑制剂, IC50 为 5 nM。Temuterkib 作用于 BRAF 和 RAS 突变癌细胞系中, 有效抑制 p-RSK1。Temuterkib 在 MAPK 途径改变的癌症模型中具有强大的抗肿瘤活性。

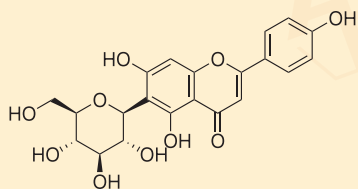


A668057 | 98%  
1951483-29-6

## JNK

### Isovitexin

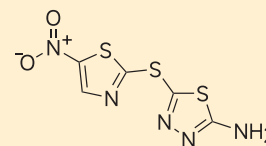
Isovitexin 是从亚洲水稻种得到的黄酮类物质, 具有抗氧化、抗炎的活性; Isovitexin 作用与 JNK1/2 的抑制剂类似, 能够抑制 NF- $\kappa$ B 的活化。



A568246 | 98%  
38953-85-4

### SU3327

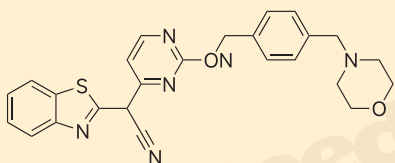
SU3327 是一种有效的, 选择性的且具有底物竞争性的 JNK 抑制剂, IC50 为 0.7  $\mu$ M。SU3327 还以 IC50 值为 239 nM 抑制 JNK 和 JIP 之间的蛋白相互作用。SU3327 对 p38  $\alpha$  和 Akt 激酶的活性较低。



A937290 | 98%  
40045-50-9

### Bentamapimod

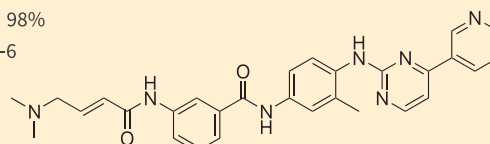
Bentamapimod (AS 602801) 是一种 ATP 竞争性的 JNK 抑制剂, 作用于 JNK1, JNK2 和 JNK3, IC50 分别为 80 nM, 90 nM 和 230 nM。



A793130 | 98%  
848344-36-5

### JNK-IN-8

JNK-IN-8 (JNK Inhibitor XVI) (GMP) 是 GMP 级别的 JNK-IN-8 (HY-13319)。GMP 级别的小分子可用做细胞疗法中的辅助试剂。JNK-IN-8 是一种有效的 JNK 抑制剂, 抑制 JNK1, JNK2 和 JNK3, IC50 分别为 4.7 nM, 18.7 nM 和 1 nM。

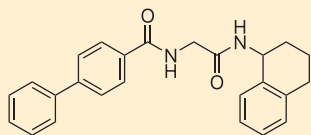


A206353 | 98%  
1410880-22-6

## TAOK

### TAO Kinase inhibitor 1

TAO Kinase inhibitor 1 (compound 43) 是一种选择性的、ATP 竞争性的 thousand-and-one amino acid kinases (TAOK) 抑制剂, 针对 TAOK1 和 TAOK2 的 IC50s 分别为 11 nM 和 15 nM。TAO Kinase inhibitor 1 延迟有丝分裂以及诱导有丝分裂细胞死亡。

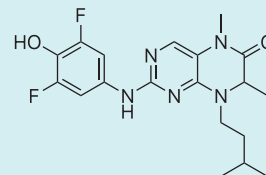


A1000438 | 99%  
850467-66-2

## RSK

### BI-D1870

BI-D1870 是ATP 竞争性的、细胞可渗透性的、能透过血脑屏障的 RSK 抑制剂, 抑制 RSK1、RSK2、RSK3、RSK4 的 IC50 值分别为 31 nM、24 nM、18 nM、15 nM。

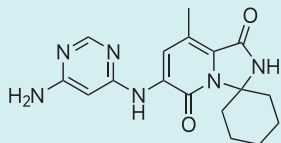


A153763 | 98%  
501437-28-1

## MNK

### Tomivosertib

Tomivosertib (eFT508) 是一种有效的、高度选择性的、口服活性的 MNK1 和 MNK2 抑制剂, IC50 值均为 1-2 nM。Tomivosertib (eFT508) 处理可降低肿瘤细胞中 eIF4E 的磷酸化水平 (位点为 Ser209, IC50=2-16 nM)。Tomivosertib (eFT508) 还显著下调 PD-L1 蛋白的丰度。

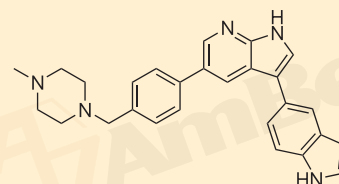


A129059 | 98%  
1849590-01-7

## MLK

### URMC-099

URMC-099 是一种口服生物有效的混合谱系激酶 3 (MLK3) (IC50=14 nM) 抑制剂, 具有优异的血脑屏障穿透性。

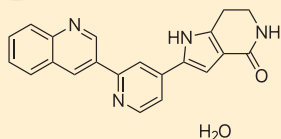


A521108 | 98+%  
1229582-33-5

## MK2

### MK2-IN-3 hydrate

MK2-IN-3 hydrate (compound 16) 是一种具有口服活性的、选择性的、ATP 竞争性的 MAPKAP-K2 (MK-2) 抑制剂, IC50 值为 0.85 nM。MK2-IN-3 hydrate 对 MK-3 (IC50=0.21 μM), MK-5 (IC50=0.081 μM), ERK2 (IC50=3.44 μM), MNK1 (IC50=5.7 μM) 以及 CDK2, JNK2, IKK2, MSK1, and MSK2 也具有选择性。

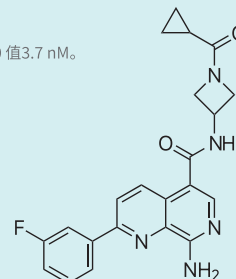


A699021 | 95+%  
1186648-22-5

## MAP4K4

### GENE-495

GENE-495 是有效, 选择性的 MAP4K4 抑制剂, IC50 值 3.7 nM。

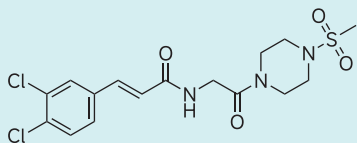


A165313 | 97%  
1449277-10-4

## KLF

### SR18662

SR18662 是一种有效的 Kruppel-like factor 5 (KLF5) 的抑制剂, IC50 为 4.4 nM, ML264 (HY-19994) 的类似物。SR18662 可用于结直肠癌的相关研究。

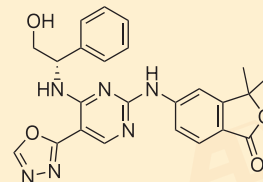


A1493794 | 95%  
2505001-62-5

## HPK1

### HPK1-IN-7

HPK1-IN-7 是一种有效的口服活性 HPK1 (造血祖细胞激酶1, MAP4K1) 抑制剂 (IC50=2.6 nM), 具有优良的家族和激酶组选择性。HPK1-IN-7 对 IRAK4 (59 nM) 和 GLK (140 nM) 具有选择性。HPK1-IN-7 联合抗 PD1 对 MC38 同基因肿瘤模型显示出强大的疗效。



A1378139 | 97%  
2320462-65-3



扫码领取电子版

# MAPK / ERK pathway

| 货号       | 名称                              | 靶点       | 纯度   |
|----------|---------------------------------|----------|------|
| A342718  | RAF265                          | VEGFR    | 98%  |
| A1000438 | TAO Kinase inhibitor 1          | TAOK     | 99%  |
| A137621  | LY-2584702 tosylate salt        | RSK      | 98+% |
| A125389  | LY-2584702 free base            | RSK      | 98+% |
| A674211  | Raf inhibitor 1 dihydrochloride | Raf      | 98+% |
| A471753  | GW 5074                         | Raf      | 98%  |
| A802126  | AZ304                           | Raf      | 97%  |
| A117299  | Sorafenib Tosylate              | Raf      | 98%  |
| A878726  | XRK3F2                          | Raf      | 99+% |
| A312190  | Encorafenib                     | Raf      | 98%  |
| A484347  | Dabrafenib                      | Raf      | 98%  |
| A117880  | Raf inhibitor 1                 | Raf      | 98+% |
| A268279  | Vemurafenib                     | Raf      | 98%  |
| A116840  | Vemurafenib                     | Raf      | 98+% |
| A840010  | PLX8394                         | Raf      | 98%  |
| A1158776 | Belvarafenib                    | Raf      | 98%  |
| A986611  | L-779450                        | Raf      | 98+% |
| A175274  | ZM 336372                       | Raf      | 98%  |
| A720977  | SB-590885                       | Raf      | 98%  |
| A316727  | Sorafenib                       | Raf      | 99%  |
| A107516  | Tovorafenib                     | Raf      | 98%  |
| A1176803 | LUT014                          | Raf      | 98%  |
| A244638  | Dabrafenib Mesylate             | Raf      | 99%  |
| A332013  | PLX-4720                        | Raf      | 99+% |
| A880021  | Raf inhibitor 2                 | Raf      | 98%  |
| A344788  | LXH254                          | Raf      | 97%  |
| A417155  | LY3009120                       | Raf      | 98%  |
| A530681  | PD 169316                       | p38 MAPK | 95%  |
| A710495  | SB 242235                       | p38 MAPK | 98%  |
| A724338  | Dilmapiomod                     | p38 MAPK | 98%  |
| A251928  | SKF-86002                       | p38 MAPK | 98%  |
| A413122  | Ralimetinib dimesylate          | p38 MAPK | 98+% |
| A100781  | Losmapimod                      | p38 MAPK | 98%  |
| A192063  | Ferulic acid methyl ester       | p38 MAPK | 98%  |
| A756758  | VX-702                          | p38 MAPK | 99%  |
| A103377  | Doramapimod                     | p38 MAPK | 99%  |
| A628708  | Pamapimod                       | p38 MAPK | 98+% |

| 货号       | 名称                              | 靶点       | 纯度   |
|----------|---------------------------------|----------|------|
| A342976  | Skepinone-L                     | p38 MAPK | 98%  |
| A151588  | CGP 57380                       | MNK      | 98+% |
| A781993  | SLV-2436                        | MNK      | 97%  |
| A129059  | Tomivosertib                    | MNK      | 98%  |
| A229094  | Tinodasertib                    | MNK      | 97%  |
| A521108  | URMC-099                        | MLK      | 98+% |
| A950511  | MK2-IN-3                        | MK2      | 98%  |
| A203074  | GS-444217                       | MEK      | 98+% |
| A813133  | DTP3                            | MEK      | 98%  |
| A420396  | GDC-0623                        | MEK      | 99+% |
| A1372186 | ASK1-IN-1                       | MEK      | 98%  |
| A194061  | Binimetinib                     | MEK      | 98+% |
| A832312  | CI-1040                         | MEK      | 98%  |
| A370482  | Mirdametinib                    | MEK      | 98%  |
| A511821  | BIX02189                        | MEK      | 98%  |
| A151521  | Refametinib                     | MEK      | 98+% |
| A139600  | SL327                           | MEK      | 98+% |
| A156190  | Selonsertib                     | MEK      | 97%  |
| A265446  | OTS514                          | MEK      | 98%  |
| A351367  | Selumetinib                     | MEK      | 98%  |
| A364339  | APS-2-79 hydrochloride          | MEK      | 98%  |
| A286366  | Trametinib (DMSO solvate)       | MEK      | 98%  |
| A217615  | OTS964 hydrochloride            | MEK      | 98%  |
| A578981  | Zapnometinib                    | MEK      | 97%  |
| A282482  | PD98059                         | MEK      | 98%  |
| A189385  | Isorhamnetin                    | MEK      | 97%  |
| A665681  | BIX02188                        | MEK      | 98%  |
| A302457  | BIX-02188(Random Configuration) | MEK      | 97%  |
| A199908  | Pimasertib                      | MEK      | 98%  |
| A132258  | U0126-EtOH                      | MEK      | 98%  |
| A188937  | Trametinib                      | MEK      | 98%  |
| A473635  | AZD8330                         | MEK      | 99+% |
| A1176981 | GW284543                        | MEK      | 98%  |
| A1493794 | SR18662                         | KLF      | 95%  |
| A183374  | ML264                           | KLF      | 98%  |
| A623864  | TIC10                           | Akt      | 99+% |

| 货号       | 名称                           | 靶点  | 纯度   |
|----------|------------------------------|-----|------|
| A162263  | Ulixertinib                  | ERK | 99%  |
| A480964  | MK-8353                      | ERK | 95%  |
| A812686  | ERK5-IN-1                    | ERK | 98%  |
| A214234  | Ulixertinib hydrochloride    | ERK | 98%  |
| A668057  | Temuterkib                   | ERK | 98%  |
| A1362224 | ASTX029                      | ERK | 98%  |
| A1482313 | Magnolin                     | ERK | 98+% |
| A638069  | Magnolin                     | ERK | 98%  |
| A260385  | VX-11e                       | ERK | 98%  |
| A370232  | XMD17-109                    | ERK | 98%  |
| A1329219 | SKI V                        | ERK | 98%  |
| A1482313 | Magnolin                     | ERK | 98+% |
| A638069  | Magnolin                     | ERK | 98%  |
| A378792  | SCH772984                    | ERK | 98%  |
| A146338  | XMD8-92                      | ERK | 98%  |
| A170354  | Ravoxertinib                 | ERK | 98%  |
| A580222  | Tizaterkib                   | ERK | 98+% |
| A1164824 | ERK5-IN-2                    | ERK | 98%  |
| A315608  | DEL-22379                    | ERK | 98%  |
| A154752  | Tauroursodeoxycholate sodium | ERK | 98%  |
| A867944  | FR 180204                    | ERK | 98%  |
| A1194999 | BCI-215                      | ERK | 98%  |

| 货号      | 名称                   | 靶点  | 纯度   |
|---------|----------------------|-----|------|
| A235149 | Auraptene            | JNK | 99%  |
| A537026 | JNK-IN-7             | JNK | 98+% |
| A155219 | SP600125             | JNK | 98%  |
| A166355 | BI-78D3              | JNK | 98%  |
| A101734 | CC-401 hydrochloride | JNK | 98%  |
| A148034 | Tanzisertib          | JNK | 98%  |
| A937290 | SU3327               | JNK | 98%  |
| A206353 | JNK-IN-8             | JNK | 98%  |
| A568246 | Isovitexin           | JNK | 98%  |
| A793130 | Bentamapimod         | JNK | 98%  |

www.ambeed.cn

