

カプマチニブの阻害活性

阻害活性

阻害活性

阻害活性

阻害活性

Baltschukat, S., et al.: Clin Cancer Res. 25(10), 3164-3175, 2019

カプマチニブの阻害活性

カプマチニブの阻害活性

カプマチニブの阻害活性 MET の K_D 0.31 nM、MET (M1250T) の K_D 0.69 nM、MET (Y1235D) の K_D 0.53 nM、
 MET の K_D 500 nM、MET の K_D 1000 nM

カプマチニブの阻害活性 442 の K_D 9

Image

キナーゼ	カプマチニブ 10 μM におけるリガンド結合率 (%) ^{a)}	K_D (nM) ^{b)}
ABL1 (H396P変異)非リン酸化型	13	3200
AXL	12	1100
CDK11	23	5700
IRAK1	1.6	500
MET	3.6	0.31
MET (M1250T)	1.2	0.69
MET (Y1235D)	2.4	0.53
PIP5K2C	24	>10000
YSK4	17	2100

a) カプマチニブ 10 μM におけるリガンド結合率 (%) は、 K_D が 100 nM 未満のキナーゼに対しては、 K_D の値を基に計算された。n = 1

b) カプマチニブ 10 μM におけるリガンド結合率は、 K_D が 10000 nM 以上のキナーゼに対しては、 K_D の値を基に計算された。n = 2

カプマチニブ 10 μM におけるリガンド結合率は、442 のキナーゼに対しては、65% のキナーゼに対しては、35% のキナーゼに対しては、9 のキナーゼに対しては、 K_D の値を基に計算された。

2 MET MET

Fujino, T., et al.: J Thorac Oncol. 14(10), 1753-1765, 2019

MET 14 Y1003F Pro-B Ba/F3 MET 14 Y1003F IC₅₀ 0.6nM

MET MET

Image

由来	変異	カプマチニブ	テボチニブ
		IC ₅₀ (nM)	
マウスPro-B細胞株Ba/F3	野生型+IL3	>1000	>1000
	エクソン14スキッピング	0.6	3.0
	Y1003F	0.6	2.4
	D1010Y	0.4	1.3
	TPR-MET	2.2	24
ヒト胃癌由来細胞株	Hs746t(エクソン14スキッピング)	1.6	2.2
C _{max} (nM)		9068	2621
C _{trough} (nM)		N/A	N/A

N/A

Pro-B Ba/F3 50% IC₅₀

□□□□□□□□□□

□□□□□□□□□□

□□□□□

Source URL: <https://www.pro.novartis.com/jp-ja/products/tabrecta/pharmacology/02>