

カプマチニブ

カプマチニブ

カプマチニブ

カプマチニブ

カプマチニブ

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

カプマチニブ

カプマチニブ

カプマチニブMETのK_dは0.31nM、MET M1250T Y1235DのK_dは0.69nM、0.53nM、METの6倍のK_dは500nM、METのK_dは1000倍のK_dは

カプマチニブ442のK_dは9倍のK_dは

Image

キナーゼ	カプマチニブ10μM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10μMにおけるリガンド結合率(%)は、カプマチニブ10μMとリガンドの濃度の比を100%とし、0%から100%までの範囲で測定された。n=1

b) カプマチニブ11倍のK_dは0.17?10000nM、カプマチニブのK_dはn=2

カプマチニブ10μMにおける442の結合率は65%、カプマチニブの結合率は35%、カプマチニブのK_dは9倍のK_dは

2METMET

Fujino, T., et al.: J Thorac Oncol. 1410, 1753-1765, 2019

MET14Y1003FPro-BBa/F3MET14Y1003FIC₅₀0.6nM

METMET

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-BBa/F350%IC₅₀

□□□□□□□□□□

□□□□□□□□□□

□□□□□

Source URL: <https://loadtest.pro.novartis.com/products/tabrecta/pharmacology/02>