NOVARTIS

□□□□□□□□□□□□□□□□□□

□□□□□□

□□□□

□□□□□□□□□□□

□1□□□□□□□□□□□□□□

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

□□□□□□□□□□□MET□□□□K_D□0.31nM□□□□MET□M1250T□□Y1235D□□□□□K_D□□□□□0.69nM□□0.53nM
□□□□□□□□MET□□□6□□□□□□□□□□□□K_D□500nM□□□□□□□MET□□□□K_D□□1000□□□□□□□

□□□□□□□□□□□□□□□□□□442□□□□□□□□□□□□□9□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□K_D□

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□□□%□□□□□□□100□□0□□□□□□□□
□□□□□□□□10μM□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□%□□n=1□

b□□□□□□□□□□□□□□□11□□□0.17?10000nM□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□K_D□□□□□n=2□

□□□□□□□□□□□□□□□10μM□□□□□442□□□65%□□□□□□□□□□□□□□
□35%□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□9□□□□□□□□□□□□□□□□□□□K_D□□□□□□□□

□2□MET□□□□□MET□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□□

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

□□□□□□□□□□□□□□

□□□□□□□□□□□□□□□□□

□□□□□□□

Source URL: *https://www.loadtest.pro.novartis.com/products/tabrecta/pharmacology/02*