

# NanoBRET™ TE Intracellular キナーゼセルベースアッセイサービス

インタクトな細胞内で全長発現されたキナーゼタンパク質に対する化合物の作用を探る

1タイプの細胞透過性トレーサーで幅広いキナーゼタンパク質ターゲット探索が可能

カルナバイオサイエンスはNanoBRET™ Target Engagement (TE) Intracellular Kinase Assay System (Promega社)を用いたセルベースアッセイサービスを開始いたしました。

今なら全てのIC<sub>50</sub>測定試験を **50% Off** にてご提供  
(2019年2月末受注分まで)

詳しくはこちらまで

ヒトキナーゼに対する薬剤の効能をより正確に予測するためにはターゲットタンパク質-化合物間の相互作用を生体内に近い細胞内環境で評価し、薬剤の阻害能、選択性、親和性を定量測定することが極めて重要です。また、平衡状態における測定に加え、カインेटックスを評価し、薬剤のResidence Timeなど速度論的パラメータにも薬剤の最適化において考慮することが望まれています。NanoBRET™ Target Engagement (TE) Intracellular Kinase Assay System (Promega社)を用いた当社提供のセルベースアッセイサービスでは、リストからご希望のキナーゼターゲットをご選択頂き生体内に近い条件の下、そのターゲットに対してお客様の化合物がどのように作用するのかを評価、定量的な結果をお届けいたします。

化合物をお送り頂くだけで、インタクトな細胞内で測定されたIC<sub>50</sub>値、阻害率、そして Residence Time 評価結果を得ることが可能です。

## 提供測定サービス

### 阻害率測定試験

(10倍希釈系列3濃度測定、n=1/n=2)

### IC<sub>50</sub>値測定試験

(Half-Log希釈系列8濃度測定、n=1/n=2)

試験期間：化合物受領後2週間

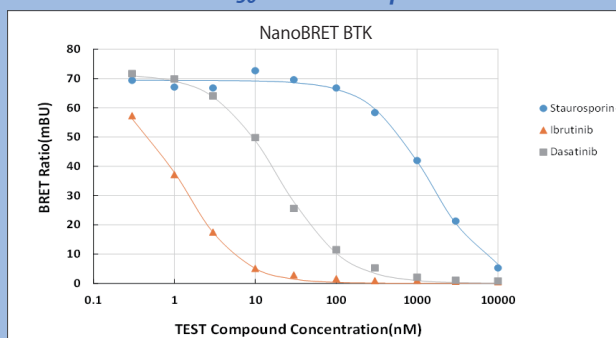
### Residence Time解析\*

(IC<sub>50</sub>値測定試験の結果をベースにn=3で行います)

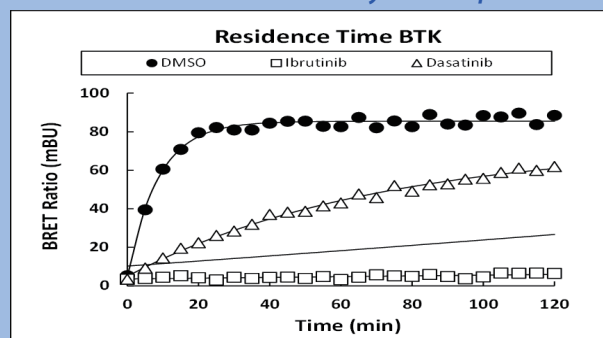
試験期間：濃度決定後3週間

\*Residence Time解析をご利用いただく前に試験濃度設定の為、IC<sub>50</sub>値測定試験をご利用いただく必要がございます。

## IC<sub>50</sub> Data Sample



## Residence Time Analysis Sample



当社ホームページから申込書をダウンロードいただき、必要事項をご記入の上、メールにてお送りください。  
次頁リストに無いターゲットにつきましてはご相談ください。

# NanoBRET™ TE Intracellular Kinase Cell-Based Assay Service ターゲットリスト

青字のターゲットは当社にて評価済のものです。  
青字以外のターゲットの納期につきましてはお問い合わせ下さい。

Kinase Name	Kinase Name	Kinase Name	Kinase Name	Kinase Name
AAK1	CDK8 / Cyc C	GSK3A	MAST4	PTK2B
ABL1	CDK9 / Cyc K	GSK3B	MELK	PTK6
ABL1(E255K)	CDK9 / Cyc T1	HIPK2	MET	RET
ABL1(F317I)	CDKL1	HIPK4	MET(M1250T)	RET(M918T)
ABL1(F317L)	CDKL2	ICK	MET(Y1235D)	RET(V804L)
ABL1(H396P)	CDKL3	IGF1R	MKNK1	RET(V804M)
ABL1(M351T)	CDKL5	IKBKE	MKNK2	RIOK2
ABL1(Q252H)	CHEK1	INSR	MLTK	RIPK1
ABL1(Y253F)	CLK1	IRAK1	MOK	RIPK2
ABL2	CLK2	IRAK3	MUSK	RON
ACVR1	CLK4	IRAK4	MYLK2	RPS6KA1
ACVR1B	COQ8B	ITK	MYLK3	RPS6KA2
ACVRL1	CSF1R	JAK2	MYLK4	RPS6KA3
ADK	CSK	JAK2 (V617F)	NEK11	RPS6KA4
AKT2	CSNK1A1L	JAK2_JH1 Domain	NEK2	RPS6KA6
ALK(L1196M)	CSNK1D	JAK3	NEK3	SBK3
AMHR2	CSNK1E	JNK1	NEK4	SGK1
AURKA	CSNK1G2	JNK3	NEK5	SIK1
AURKB	CSNK2A1	Kit	NEK9	SIK3
AURKC	CSNK2A2	KIT(A829P)	NIM1K	SLK
AXL	DAPK2	KIT(D816H)	NLK	SNF1LK2
BLK	DCLK1	KIT(D816V)	NTRK1v1	SNRK
BMP2K	DCLK3	KIT(L576P)	NTRK1v2	SRC
BMPR1A	DDR1	KIT(V559D)	NTRK2	SRMS
BMX	DDR2	KIT(V559D,T670I)	NUAK1	STK10
BRSK1	DYRK1A	LATS1	NUAK2	STK16
BRSK2	DYRK1B	LATS2	PAK4	STK3
BTK	EIF2AK4k2	LCK	PAK6	STK32A
CAMK2A	EPHA1	LIMK1	PAK7	STK32B
CAMK2D	EPHA2	LIMK2	PHKG1	STK33
CAMK2G	EPHA4	LRRK2	PHKG2	STK35
CDK1 / Cyc B1	EPHA5	LRRK2(G2019S)	PIK3C3	STK36
CDK1 / Cyc B2	EPHA6	LTK	PIK3CA	STK38
CDK1 / Cyc E1	EPHA7	LYN	PIK3CA(C420R)	STK38L
CDK1 / Cyc K	EPHA8	MAP3K10	PIK3CA(E542K)	STK4
CDK10 / Cyc L2	EPHB1	MAP3K11	PIK3CA(E545A)	TBK1
CDK11A / Cyc K	EPHB2	MAP3K12	PIK3CA(E545K)	TEC
CDK11A / Cyc L2	EPHB3	MAP3K19	PIK3CA(H1047L)	TEK
CDK14 / Cyc Y	EPHB4	MAP3K2	PIK3CA(H1047R)	TESK1
CDK15 / Cyc Y	ERN1	MAP3K21	PIK3CA(H1047Y)	TGFB2
CDK16 / Cyc Y	ERN2	MAP3K3	PIK3CA(I800L)	TIE1
CDK17 / Cyc Y	FER	MAP3K4	PIK3CA(M1043I)	TIE2
CDK18 / Cyc Y	FES	MAP3K9	PIK3CA(Q546K)	TLK1
CDK19 / Cyc C	FGFR1	MAP4K1	PIK3CB	TLK2
CDK2	FGFR2	MAP4K2	PIK3CD	TNK1
CDK2 / Cyc A1	FGFR3	MAP4K3	PIKFYVE	TNK2
CDK2 / Cyc A2	FGFR4	MAP4K5	PIP4K2C	TNNI3K
CDK2 / Cyc E1	FGR	MAPK1	PIP5K1B	TRKA
CDK20 / Cyc H	FLT1	MAPK11	PKMYT1	TTK
CDK3 / Cyc E1	FLT3	MAPK13	PLK2	TXK
CDK4 / Cyc D1	FLT3(D835H)	MAPK14	PLK3	TYK2
CDK4 / Cyc D3	FLT3(D835V)	MAPK3	PLK4	TYK2_JH2 Domain
CDK5	FLT3(D835Y)	MAPK4	PRKAA2	TYRO3
CDK5 / CDK5R1	FLT3(K663Q)	MAPK6	PRKACA	ULK1
CDK5 / CDK5R2	FLT3(N841I)	MAPK8	PRKACB	ULK2
CDK6 / Cyc D1	FLT3(R834Q)	MAPK9	PRKCE	ULK3
CDK6 / Cyc D3	FRK	MARK2	PRKG2	WEE1
CDK7	FYN	MARK3	PRKX	WEE2
CDK7 / Cyc H	GAK	MARK4	PTK2	YES1

2018/11/27

お知らせ：掲載の内容は予告なく変更する場合があります。予めご了承下さい。