

Таблица 2. Таргетные препараты (малые молекулы), используемые в онкологической практике в мире

Table 2. Targeted drugs (small molecules) used worldwide for cancer therapy

| Молекулярная мишень Molecular target | Название препарата Drug | Таргетная мишень Target | Механизм действия Mechanism of action | Регистрация препарата (EMA или FDA) Marketing authorisation (by EMA or FDA) | Показания к применению Indications for use |
|--|---|--|---|--|---|
| Тирозин & Серин / треонинкиназы Tyrosine and Serine / Threonine kinases | Афатиниб Afinatinib | EGFR | Ингибитор тирозинкиназы EGFR EGFR tyrosine kinase inhibitor | 2012 | Местнораспространенный или метастатический немелкоклеточный рак легкого с мутацией рецептора EGFR Locally advanced and metastatic non-small-cell lung cancer |
| | Акситиниб Axitinib | VEGFR-1, -2, -3 | Ингибитор тирозинкиназы VEGFR-1, VEGFR-2 и VEGFR-3 Inhibitor of VEGFR-1, VEGFR-2, and VEGFR-3 tyrosine kinases | 2005 | Почечно-клеточный рак Renal cell carcinoma |
| | Бозутиниб Bosutinib | Bcr-Abl | Ингибитор тирозинкиназы Tyrosine kinase inhibitor | 2011 | Хронический миелолейкоз с положительной филадельфийской хромосомой Philadelphia chromosome-positive chronic myeloid leukemia |
| | Кабозантиниб Cabozantinib | MET, VEGF | Ингибитор тирозинкиназы Tyrosine kinase inhibitor | 2012 | Рак щитовидной железы Thyroid cancer |
| | Цертиниб Cerinib | ALK | Ингибитор тирозинкиназы Tyrosine kinase inhibitor | 2014 | ALK-позитивный немелкоклеточный рак легкого ALK-positive non-small-cell lung cancer |
| | Кризотиниб Crizotinib | ALK | Ингибитор тирозинкиназы Tyrosine kinase inhibitor | 2014 | Немелкоклеточный рак легкого Non-small-cell lung cancer |
| | Дазатиниб Dasatinib | Bcr-Abl, тирозинкиназы семейства SRC (SRC, LCK, YES, FYN), c-KIT, EphA2 и PDGFR бета Bcr-Abl, SRC family tyrosine kinases (SRC, LCK, YES, FYN), c-KIT, EphA2, and PDGFR-β | Ингибитор тирозинкиназ Tyrosine kinase inhibitor | | Хронический миелолейкоз, рак предстательной железы Chronic myeloid leukemia, prostate cancer |
| | Эрлотиниб Erlotinib | EGFR | Ингибитор тирозинкиназы, направлен на сайт связывания АТФ EGFR и способен ингибировать активацию сигнального пути MAPK, и PI3K/A Tyrosine kinase inhibitor targeting the ATP-binding site of EGFR and capable of inhibiting activation of MAPK and PI3K/A signaling pathways | 2005 | Немелкоклеточный рак легкого, рак поджелудочной железы Non-small-cell lung cancer, pancreatic cancer |
| | Гефитиниб Gefitinib | | | 2003 | Местнораспространенный или метастатический немелкоклеточный рак легкого Locally advanced and metastatic non-small-cell lung cancer |
| | Ибрутиниб Ibrutinib | BTK | Ингибитор тирозинкиназы Брутона (BTK) Bruton's tyrosine kinase (BTK) inhibitor | 2013 | Хронический лимфоцитарный лейкоз Chronic lymphocytic leukemia |
| | Иматиниб Imatinib | Bcr-Abl | Блокирует тирозинкиназу Bcr-Abl Blocks Bcr-Abl tyrosine kinase | 2001 | Хронический миелолейкоз Chronic myeloid leukemia |
| | Лапатиниб Lapatinib | ErbB1, ErbB2/HER2/neu рецепторы ErbB1, ErbB2/HER2/neu receptors | Обратимый ингибитор тирозинкиназы Reversible tyrosine kinase inhibitor | 2007 | Распространенный и/или метастатический рак молочной железы с гиперэкспрессией HER2 HER2-overexpressing advanced and/or metastatic breast cancer |
| | Пазопаниб Pazopanib | VEGFR-1, -2, -3, PDGFR, FGFR-1 и -3, Kit, c-Fms, Itk, индуцируемая ИЛ-2, Lck VEGFR-1, -2, -3, PDGFR, FGFR-1 and -3, Kit, c-Fms, Itk, Lck | Ингибитор тирозинкиназ Tyrosine kinase inhibitor | 2009 | Распространенный почечноклеточный рак, саркома мягких тканей Advanced renal cell carcinoma, soft tissue sarcoma |
| | Руксолитиниб Ruxolitinib | JAK1, JAK2 | Ингибитор JAK-киназ JAK inhibitor | 2011 | Почечноклеточная карцинома, гепатоцеллюлярная карцинома Renal cell carcinoma, hepatocellular carcinoma |
| | Дабрафениб Dabrafenib | BRAF | Ингибитор протеинкиназ Protein kinase inhibitor | | Метастатическая меланома Metastatic melanoma |
| | Вемурафениб Vemurafenib | | | | |
| | Траметиниб Trametinib | | | | |
| | Кобиметиниб Cobimetinib | MEK | Ингибитор MEK MEK inhibitor | | |
| | Эверолимус Everolimus | MTOR | Ингибитор протеинкиназ Protein kinase inhibitor | 2009 | Нейроэндокринная опухоль поджелудочной железы, желудочно-кишечного тракта или легкого, карцинома почки, неоперабельная субэпидимальная гигантоклеточная астроцитомы, связанная с туберозным склерозом, рак молочной железы (HR+, HER2-) Neuroendocrine tumors of pancreatic, gastrointestinal or lung origin, renal carcinoma, inoperable subependymal giant cell astrocytoma associated with tuberous sclerosis, breast cancer (HR+, HER2-) |
| | Рибоциклиб Ribociclib | CDK4, CDK6 | Ингибитор CDK4 и CDK6 CDK4 and CDK6 inhibitor | | Рак молочной железы (HR+, HER2-) Breast cancer (HR+, HER2-) |
| Сорафениб Sorafenib | VEGFR-1, -2, -3, KIT, FLT-3, PDGFR-β, RET | Ингибитор внутриклеточных киназ Intracellular kinase inhibitor | 2007 | Метастатический почечно-клеточный рак, печеночно-клеточный рак, местнораспространенный или метастатический дифференцированный рак щитовидной железы, резистентный к радиоактивному йоду Metastatic renal cell carcinoma, hepatocellular carcinoma, locally advanced or metastatic radioactive iodine-refractory differentiated thyroid cancer | |
| Протеасомы и другие белки, играющие роль в путях трансдукции сигнала Proteasomes and other proteins that are involved in signal transduction pathways | Бортезомиб Bortezomib | 26S-протеасома 26S proteasome | Ингибитор протеасомы Proteasome inhibitor | 2003 | Множественная миелома Multiple myeloma |
| | Карфилзомиб Carfilzomib | 20S-протеасома 20S proteasome | Ингибитор протеасомы Proteasome inhibitor | 2012 | Рецидивирующая множественная миелома Relapsed multiple myeloma |
| Апоптоз Apoptosis | Обатоклак Obatoclox | BCL-2 | Ингибитор BCL-2 BCL-2 inhibitor | — | Клинические испытания для лечения лейкозов, лимфомы, миелофиброза и мастоцитоза Clinical trials investigating the use of the drug for the treatment of leukemia, lymphoma, myelofibrosis, and mastocytosis |
| | Навитоклак Navitoclox | BCL-2, Bcl-XL, Bcl-w | Ингибитор BCL-2, Bcl-X _L и Bcl-w BCL-2, Bcl-X _L , and Bcl-w inhibitor | — | Клинические испытания при нескольких видах лимфом Clinical trials for several types of lymphoma |

Примечание. EGFR — рецептор эпидермального фактора роста; VEGF — фактор роста эндотелия сосудов; VEGFR — рецептор фактора роста эндотелия сосудов; Bcr-Abl — тирозинкиназа, ответственная за онкогенную трансформацию клеток; ErbB-1(EGFR) — трансмембранный рецептор, связывающий внеклеточные лиганды из группы эпидермальных факторов роста. Относится к семейству рецепторов ErbB, в частности к подсемейству тирозинкиназных рецепторов (обладающих внутренней тирозинкиназной активностью); EGFR (ErbB-1), HER2/c-neu (ErbB-2) — рецептор эпидермального фактора роста человека 2 типа; MET — рецептор фактора роста гепатоцитов; ALK — киназа анапластической крупноклеточной лимфомы; BTK — тирозинкиназа Брутона; FGFR-1, -3 — рецепторы фактора роста фибробластов; KIT — рецептор фактора стволовых клеток; FLT3 — рецептор Fms-подобной тирозинкиназы-3; c-Fms — рецептор колониестимулирующего фактора макрофагов; Itk — T-клеточная киназа, индуцируемая ИЛ-2; Lck — лейкоцитспецифическая протеинтирозинкиназа; JAK — янус-киназы; BRAF — белок-кодирующий ген, BRAf — серин/треонин киназа, участвующая в функционировании высокоонкогенных сигнальных путей RAS/RAF/MEK/ERK; MTOR — мишень рапамицина у млекопитающих; CDK4 и CDK6 — циклинзависимые киназы 4 и 6; FLT-3 — рецептор Fms-подобной тирозинкиназы-3; PDGFR-β — рецептор тромбоцитарного фактора роста; RET — рецептор нейротрофического глиального фактора; BCL-2, Bcl-XL и Bcl-w — антиапоптотические белки; сигнальный путь MAPK — митоген-активируемая протеинкиназа; сигнальный путь PI3K/AKT — фосфатидилинозитол-3-киназы и протеинкиназы B; MEK — киназы митоген-активируемой протеинкиназы.

Note. EGFR—epidermal growth factor receptor; VEGF—vascular endothelial growth factor; VEGFR—vascular endothelial growth factor receptor; Bcr-Abl—tyrosine kinase responsible for oncogenic transformation of cells; ErbB-1(EGFR)—transmembrane receptor binding extracellular ligands from the group of epidermal growth factors. It belongs to the ErbB receptor family, to the subfamily of tyrosine kinase receptors with intrinsic tyrosine kinase activity, in particular; EGFR (ErbB-1), HER2/c-neu (ErbB-2)—human epidermal growth factor receptor of type 2; MET—hepatocyte growth factor receptor; ALK—anaplastic large cell lymphoma kinase; BTK—Bruton's tyrosine kinase; FGFR-1, -3—fibroblast growth factor receptors; KIT—stem cell factor receptor; FLT3—FMS-like tyrosine kinase 3; c-Fms—macrophage colony stimulating factor receptor; Itk—IL-2 inducible T-cell kinase; Lck—leukocyte specific protein tyrosine kinase; JAK—Janus kinases; BRAF—protein-coding gene, BRAf—serine/threonine kinase involved in the functioning of highly oncogenic RAS/RAF/MEK/ERK pathways; MTOR—mammalian target of rapamycin; CDK4 and CDK6—cyclin-dependent kinases 4 and 6; FLT-3—FMS-like tyrosine kinase 3 receptor; PDGFR-β—platelet-derived growth factor receptor; RET—glial neurotrophic factor receptor; BCL-2, Bcl-XL, and Bcl-w—BCL-2, Bcl-XL, and Bcl-w antiapoptotic proteins; MAPK signaling pathway—mitogen-activated protein kinase; PI3K/AKT—phosphatidylinositol-3 kinase/protein kinase B; MEK—kinases of mitogen-activated protein kinase.