

In vitro 代謝試験

In vitro 代謝試験における様々な評価方法を確立しています。

I

In vitro 代謝安定性試験

ヒトや各動物種の肝細胞または細胞画分(ミクロソーム, S9)中の代謝速度から, 被験物質の代謝酵素に対する安定性を評価いたします。

- ◆ 酵素源
 - 凍結肝細胞, ミクロソーム, S9 等
- ◆ 測定・評価方法
 - 酵素源とインキュベーションした後の被験物質を定量し, 未変化体の残存率から代謝クリアランス(CL_{int})を算出

II

代謝酵素同定試験

被験物質の代謝に関与する薬物代謝酵素について, ヒト肝細胞画分または代謝酵素の発現系ミクロソームを用いて評価いたします。

- ◆ 酵素源
 - 発現系ミクロソーム(CYP, UGT, SULT, CES, etc), ヒト肝ミクロソーム, S9
- ◆ 評価酵素
 - 発現系酵素を用いた同定法
 - ▶CYPs, UGTs, SULTs, CESs
 - 特異的阻害剤を用いた同定法
 - ▶CYP1A2, CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6, CYP3A4/5
 - ▶その他分子種につきましてもご相談に応じます。
- ◆ 測定・評価方法
 - 酵素源(および選択的阻害剤)とインキュベーションした後の被験物質を定量し, 被験物質の代謝活性を比較して各代謝酵素の関与を評価

III

In vitro 代謝物プロファイリング試験

ヒトや各動物種の肝細胞または細胞画分(ミクロソーム, S9等)を用いて, 被験物質から生成した代謝物のプロファイルと比較評価いたします。

また, 得られた代謝物について, 高分解能MS(Orbitrap MSシステム)を用いた構造推定を実施することも可能です。

- ◆ 酵素源
 - 凍結肝細胞, ミクロソーム, S9 等
- ◆ 測定・評価方法
 - 酵素源とインキュベーションした後の未変化体および代謝物ピークのピーク面積から, 各代謝物の組成比を算出

標識体・非標識体
いずれも取扱いが可能です