

In vitro 共有結合試験

標識化合物およびその代謝物の共有結合能について、ヒト肝細胞およびマイクロソームを用いた *in vitro* の代謝反応系で評価いたします。

- ◆ 酵素源
 - ヒト凍結肝細胞, ヒト肝マイクロソーム
- ◆ 測定方法
 - ハーベスター法
 - ▶ インキュベーションした代謝反応試料をセルハーベスターを用いて洗浄し, グラスフィルターに保持したタンパクを溶解して放射能を測定
 - 遠心法
 - ▶ インキュベーションした代謝反応試料を遠心分離し, 上清を除去することにより洗浄し, 沈殿を溶解して放射能を測定
- ◆ 評価方法
 - タンパク当たりの結合量から化合物の共有結合能を評価



Caco-2細胞を用いた透過性試験

被験物質の吸収性を予測するための評価系として、Caco-2細胞単層膜を用いた被験物質の透過性を評価いたします。

- ◆ 細胞
 - Caco-2細胞
- ◆ 測定方法
 - Transwell上で分化させたCaco-2細胞単層膜のApical側(頂端側)またはBasal側(基底側)に被験物質を添加してインキュベーションし, 透過した薬物量を定量
- ◆ 評価方法
 - 透過係数(Papp)から被験物質の膜透過性を評価