

発現細胞を用いた トランスポーター評価試験

被験物質の各トランスポーター分子種に対する基質認識性および阻害活性について、安定発現細胞株を用いて評価いたします。

I

評価分子種

- ◆ MDR1, BCRP (MDCKIIまたはLLC-PK1細胞)
OATP1B1, OATP1B3, OAT1, OAT3, OCT2 (HEK293細胞)
- ◆ その他の分子種についてもご相談を承ります。

II

測定方法

- ◆ MDR1, BCRP
 - Transwellに播種したトランスポーター発現細胞の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
- ◆ OATP1B1, OATP1B3, OAT1, OAT3, OCT2
 - トランスポーター発現細胞に被験物質を添加してインキュベーションし、細胞中に取り込まれた薬物量を定量

III

評価方法

- ◆ MDR1, BCRP
 - 双方向のPappから算出した被験物質および典型基質のFlux ratioより、基質認識性および阻害活性を評価
- ◆ OATP1B1, OATP1B3, OAT1, OAT3, OCT2
 - 発現細胞への取り込み速度から基質認識性および阻害活性を評価

