

# スクリーニング

## 試験メニュー

### ヒット化合物探索

#### ▶ スクリーニング実施計画(戦略)

- ターゲットアセスメント
- スクリーニングフロー/化合物選択基準の策定
- 使用ライブラリーの提案

#### ▶ スクリーニング評価系構築

- 材料調製 (タンパク質、細胞、cDNAクローニング)
- 評価系構築
  - (酵素、GPCR、トランスポーター、イオンチャネル、核内受容体)
  - 生化学評価
  - 分子間相互作用評価
  - 生物物理学評価
  - 電気生理学評価
  - 表現型解析 (細胞株、初代培養細胞、iPS細胞)



FLIPR tetra  
(Molecular Devices)



FDSS7000EX96/384/1536  
(Hamamatsu Photonics)



IN Cell Analyzer 6000  
(GE Healthcare)



Syncropatch 384  
(Nanion)

#### ▶ ハイスループットスクリーニング (HTS) \*

- HTSの最適化 (安定化・自動化・ミニチュア化検討)
- パイロットスクリーニングによる評価系の妥当性・堅牢性の検証
- HTS 実施・解析
  - 一次スクリーニング
  - EC<sub>50</sub>/IC<sub>50</sub>測定
  - カウンタースクリーニング
  - 化合物純度測定
- ヒット化合物プロファイリング (選択性、種差、作用機序解析)

\*: BSL2／放射性同位体を用いた  
スクリーニングにも対応



HORNET HTS-10CB  
(FUJIFILM Wako)



384well dispenser  
(HORNET HTS-10CB)



Envision  
(PerkinElmer)

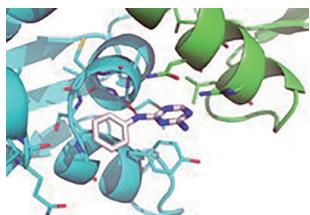
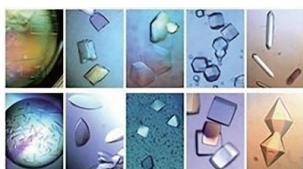


Rapidfire mass system  
(Agilent)

# 試験メニュー

## リード創出/最適化

- ▶ hit/lead/IND創出最適化ステージにおけるin vitro アッセイ
- ▶ 化合物のMOA/速度論的解析および化合物プロファイリング
- ▶ 生化学的解析
- ▶ タンパク質化合物相互作用の生物物理学的解析



- ▶ 共結晶構造解析 (SBDD、FBDD)
- ▶ 細胞機能解析
- ▶ データ解析および管理



Biacore S200  
(GE Healthcare)



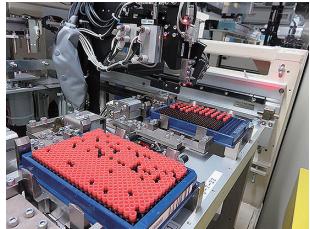
Xevo G2-S Tof  
(Waters)

## 化合物ライブラリー管理

- ▶ 化合物ロジスティクス
- 化合物管理
  - (バイアル、チューブ、プレート; 96、384、1536ウェル)
- 化合品質量管理
- 粉末秤量
- 溶液調製
- 化合物情報管理
- 外部委託化合物の管理・記録・レポート



Compound storage  
(TSUBAKIMOTO CHAIN)



Compound cherry picking  
(TSUBAKIMOTO CHAIN)

- ▶ ライブラリー管理 (コンサルティングサービス)
- ▶ 設備/機器
  - ラボオートメーション
  - 全自動化合物保管システム
  - 化合物管理ITシステム
    - (全作業工程進捗状況の管理・記録・レポート)



Echo 555  
(LABCYTE)



Automatic powder weighing  
(MICRONIX)