

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)



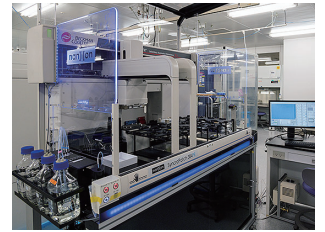
FLIPR tetra
(Molecular Devices)



FDSS7000EX96/384/1536
(Hamamatsu Photonics)



IN Cell Analyzer 6000
(GE Healthcare)



Syncropatch 384
(Nanon)

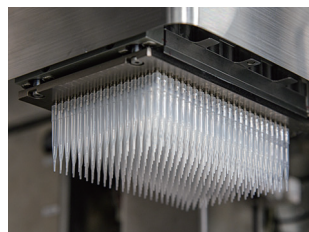
▶ ハイスループットスクリーニング (HTS) *

- 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
 - カウンタースクリーニング
 - EC_{50}/IC_{50} 測定
 - 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)

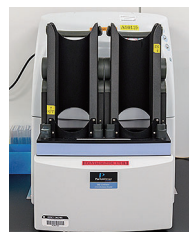
*: BSL2/放射性同位体を用いたスクリーニングにも対応



HORNET HTS-10CB
(FUJIFILM Wako)



384well dispenser
(HORNET HTS-10CB)



Envision
(PerkinElmer)

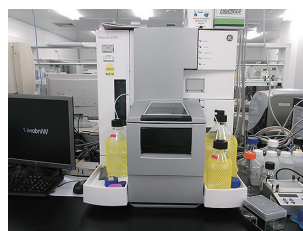
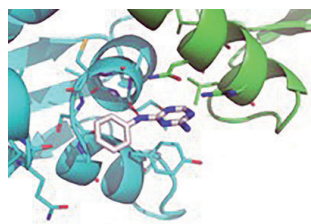
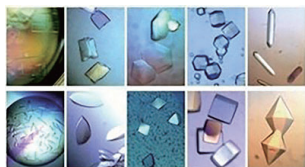


Rapidfire mass system
(Agilent)

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)



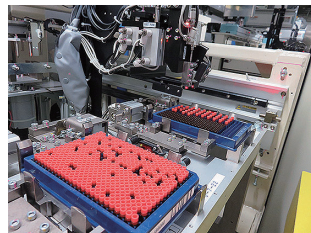
Xevo G2-S Tof
(Waters)

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)
 - 化合物品質管理
 - 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
- ▶ 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)



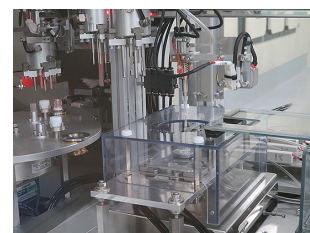
Compound storage
(TSUBAKIMOTO CHAIN)



Compound cherry picking
(TSUBAKIMOTO CHAIN)



Echo 555
(LABCYTE)



Automatic powder weighing
(MICRONIX)