

HEK293由来 ABCトランスポーター発現ベシクル

Gentest® Transportocells™-vesicles

当社では、Discovery Life Sciences社のADME/ToX研究用試薬 Gentest®を取り扱っています。
 ここでは、ABCトランスポーターを発現させた哺乳類細胞(HEK293)から調製した反転膜ベシクルである、Gentest® Transportocells™-vesiclesをご紹介します。

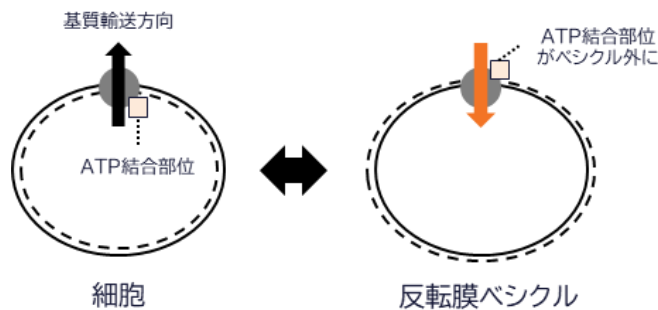
特長

- 輸送活性を取り込み方向で評価可能
- カルタヘナ法非該当
- 昆虫細胞発現品と比較して高活性



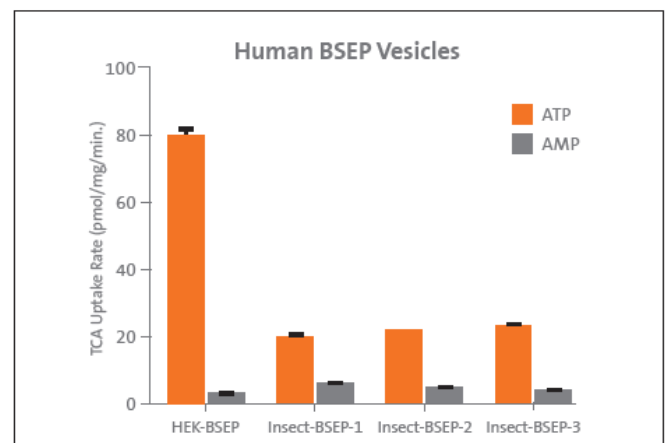
HEK293由来 ABCトランスポーターベシクル

排泄型トランスポーターであるABCトランスポーターを発現した細胞を反転したベシクルを利用することで、ベシクル外部から内部への取り込み方向で輸送活性の評価が可能となります。
 また、本製品はHEK293発現で遺伝子ベクターにプラスミドを使用しているため、カルタヘナ法の対象となりません。
 さらに、ヒトタンパクをHEK293で発現させているため、本来の翻訳後修飾状態に近いタンパクが産生され、昆虫細胞発現系に比べてより高い活性が得られます。



HEK293系と昆虫系の取り込み活性の比較

市販の3つの昆虫系-BSEPベシクルと比較し、HEK293-BSEPベシクルの1 μ Mタウロコール酸(TCA)に対する取り込み活性とS/N比は、有意に高いことが示されています。



・ 酵素反応速度論アッセイ

下表の通り、他のABCトランスポーターベシクルも含め、KmとVmaxの値は、文献等で報告されている値、あるいは昆虫系のベシクルを用いて取得した値と同程度の結果を示しています。

トランスポーター	基質	取得データ		参考データ	
		K _m (μM)	V _{max} (pmol/mg/min.)	K _m (μM)	V _{max} (pmol/mg/min.)
Human MDR1/P-gp	N-methyl-quinidine	4.9	4.624	3.65 ^a	656 ^a
Human BSEP	taurocholate	6.3	241	8.4 ^b	20.1 ^b
Human MRP2	estradiol17β-Glucuronide	124	5.751	148 ^b	1203 ^b
Human MRP3	estradiol17β-Glucuronide	4.0	116	9.1 ^c	116 ^c
Human MRP4	Dehydroepiandrosterone 3-sulfate	4.0	61	3.5 ^c	387 ^c
Human BCRP	estrone-3-sulfate	7.1	272	14.2 ^b	506 ^b

^a Herédi-Szabó K, et al. Eur J Pharm Sci. 2013, 49(4):773-81.

^b Data generated using insect cells-derived membrane vesicles by Gentest.

^c Kock K, et al. Drug Metab Dispos. 2014, 42:665-674.

製品一覧

ABCトランスポーターが機能する組織で起きる薬物相互作用は、薬物の体内動態や毒性に変化を及ぼすことが知られており、中でもMDR1/P-gpとBCRPの2種類は薬物相互作用試験に重要なトランスポーターとして、現行の規制ガイダンスで推奨されています。また、薬物誘導性肝障害におけるMRP2とBSEPの重要性が示されていることから、候補化合物とこれら2種の相互作用の可能性を検討することも重要となります。


コードNo.	メーカーコード	品名	Gene Accession No.	タンパク濃度	容量	希望納入価格 (円)
-	453800	TransportoCells™ HEK Control Vesicle	-	5 mg/mL	0.5 mL	104,300
-	453801	TransportoCells™ HEK Human MDR1/P-gp Vesicles	NM-000927	5 mg/mL	0.5 mL	157,100
552-55141	453802	TransportoCells™ HEK Human BSEP Vesicles	NM-003742	5 mg/mL	0.5 mL	157,100
-	453803	TransportoCells™ HEK Human MRP2 Vesicles	NM-000392	5 mg/mL	0.5 mL	157,100
-	453804	TransportoCells™ HEK Human BCRP Vesicles	NM-004827	5 mg/mL	0.5 mL	157,100
-	453805	TransportoCells™ HEK Human MRP3 Vesicles	NM-003786	5 mg/mL	0.5 mL	154,000
-	453806	TransportoCells™ HEK Human MRP4 Vesicles	NM-005845	5 mg/mL	0.5 mL	151,400

- ・ 本パンフレットに掲載の価格は全て2025年1月時点の価格です。
- ・ 本文に記載しております試薬は、試験・研究の目的にのみ使用されるもので、「医療品」、「食品」、「生活用品」などとして使用できません。
- ・ 希望納入価格には消費税等が含まれておりません。

富士フイルム 和光純薬株式会社

本社 〒540-8605 大阪市中央区道修町三丁目1番2号 TEL 06-6203-3741 (代表)
 東京本店 〒103-0023 東京都中央区日本橋本町二丁目4番1号 TEL 03-3270-8571 (代表)

- 九州営業所 ●中国営業所
- 東海営業所 ●横浜営業所
- 筑波営業所 ●東北営業所
- 北海道営業所

 フリーダイヤル 0120-052-099
 試薬URL : <https://labchem-wako.fujifilm.com>

■FUJIFILM Wako Chemicals U.S.A. Corporation
 1600 Bellwood Road, Richmond, VA 23237, USA
 TEL:+1-804-714-1920 FAX:+1-804-271-7791

■FUJIFILM Wako Chemicals Europe GmbH
 Fuggerstr 12, 41468 Neuss, Germany
 TEL:+49-2131-311-0 FAX:+49-2131-311-100

■富士フイルム和光(香港)有限公司
 Room 1111, 11/F, International Trade Centre,
 11-19 Sha Tsui Road, Tsuen Wan, N.T., Hong Kong
 TEL:+852-2799-9019 FAX:+852-2799-9808

■富士フイルム和光(広州)貿易有限公司
 广州市越秀区先烈中路69号东山广场30楼3002-3003室
 TEL:+86-20-8732-6381 (广州)
 TEL:+86-21-6288-4751 (上海)
 TEL:+86-10-6413-6388 (北京)