



انجازات قسم علوم الأشعة والتصوير الطبي

حصلت الكلية المركز الثاني في ملتقى مشاريع التخرج الطلابية الذي أقيم برعاية سعادة رئيس الجامعة وذلك بمشروع الطالبين سعود العتيبي و سالم العنزي من قسم الأشعة والتصوير الطبي. وتهنئ الكلية الطالبين ومشرفهم الدكتور يوسف محمد بهذا الإنجاز متمنين لهم مزيداً من التقدم والتوفيق.



حصول الدكتورة / مروى عمار السالمي على المركز الأول في
جائزة الباحث المميز
مركز بحوث العلوم الصحية



شارك مبتعث قسم الأشعة والتصوير الطبي بالكلية لدرجة الدكتوراه، أ/ عبدالله فراج العصيمي بورقة بحثية بعنوان (تطوير الببتيدات ذات العلامات الإشعاعية التي تستهدف مستقبلات CXCR4 لتصوير السرطان وعلاجه) وذلك في الندوة الدولية الثالثة عشرة للببتيد في مدينة بريسبان، أستراليا.

Radiolabelled peptides targeting CXCR4 for cancer imaging and treatment
 Abdullah F. Alosaimi, Mohammad B. Haskali, Craig A. Hutton
 School of Chemistry, The University of Melbourne,
 The Radiopharmaceutical Research Laboratory, The Peter MacCallum Cancer Centre,
 Melbourne, VIC 3000, Australia
 Alosaimi@student.unimelb.edu.au | Abdullah.Alosaimi@petermac.org

Peter Mac
 Peter MacCallum Cancer Centre
 Melbourne, Australia

جامعة Melbourne
 VISION 2030
 The University of Melbourne

Cell surface receptors that are overexpressed in cancerous tumors are feasible molecular targets for cancer imaging. The transmembrane G protein coupled receptor CXCR4 is overexpressed in tumors and has a crucial role in organ-specific metastasis of tumor cells. Cyclic pentapeptides such as FC131, cyclo(Nal-D-Tyr-D-Tyr¹⁸-Arg-Arg), and analogues have been developed to bind with high affinity and specificity to CXCR4. Unfortunately, when FC131 is radiolabelled and evaluated as a PET imaging agent, it demonstrates high retention in the liver and spleen due to its lipophilic character.¹ "Our group has previously exploited the sulfonation of tyrosine residues to improve peptide biodistribution by dramatically reducing lipophilicity";² in this work, we sulfonate the tyrosine residues to improve peptide biodistribution to reduce lipophilicity while maintaining high affinity. Evaluation of sulfonated FC131 peptide analogues as PET imaging agents has been undertaken. In addition, modification of the naphthalanamide residue of FC131 has been investigated in order to reduce lipophilicity.

Methods

1. Amino acid loading onto 3-COC resin
2. Fmoc deprotection
3. Fmoc amino acid coupling
4. N-methylation on resin (Mitsunobu)
5. Resin cleavage
6. Pentapeptide cyclization
7. Deprotection of cyclic pentapeptides
8. N-Alloc deprotection of peptide in solution
9. Coupling DOTA to peptide in solution
10. General protocols for radiolabeling

Peptides

Peptides	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	[*] Radiolabelled
1A	(2-naphthyl)-L-Ala	H	H	H	[*] Radiolabelled
2A	(3-benzoylthio)-Ala	H	H	H	[*] Radiolabelled
3A	3-(4-fluorophenyl)-L-Ala	H	H	H	[*] Radiolabelled
4A	4-fluoro-L-phenylalanine	H	H	H	[*] Radiolabelled
5A	5-fluoro-L-phenylalanine	H	H	H	[*] Radiolabelled
6A	3,4,5-trifluoro-L-phenylalanine	H	H	H	[*] Radiolabelled
7A	(2-naphthyl)-L-Ala	SO ₃ H	OH	H	[*] Radiolabelled
1B	(2-naphthyl)-L-Ala	H	H	H	[*] AMBA-DOTA
2B	(3-benzoylthio)-Ala	H	H	H	[*] AMBA-DOTA
3B	3-(4-fluorophenyl)-L-Ala	H	H	H	[*] AMBA-DOTA
4B	4-fluoro-L-phenylalanine	H	H	H	[*] AMBA-DOTA
5B	5-fluoro-L-phenylalanine	H	H	H	[*] AMBA-DOTA
6B	3,4,5-trifluoro-L-phenylalanine	H	H	H	[*] AMBA-DOTA
7B	(2-naphthyl)-L-Ala	SO ₃ H	OH	H	[*] AMBA-DOTA
Parent ¹	(2-naphthyl)-L-Ala	H	H	H	[*] AMBA-DOTA
Parent ²	(2-naphthyl)-L-Ala	H	H	H	[*] AMBA-DOTA

Sulfonated or iodinated tyrosine incorporated into SPPS

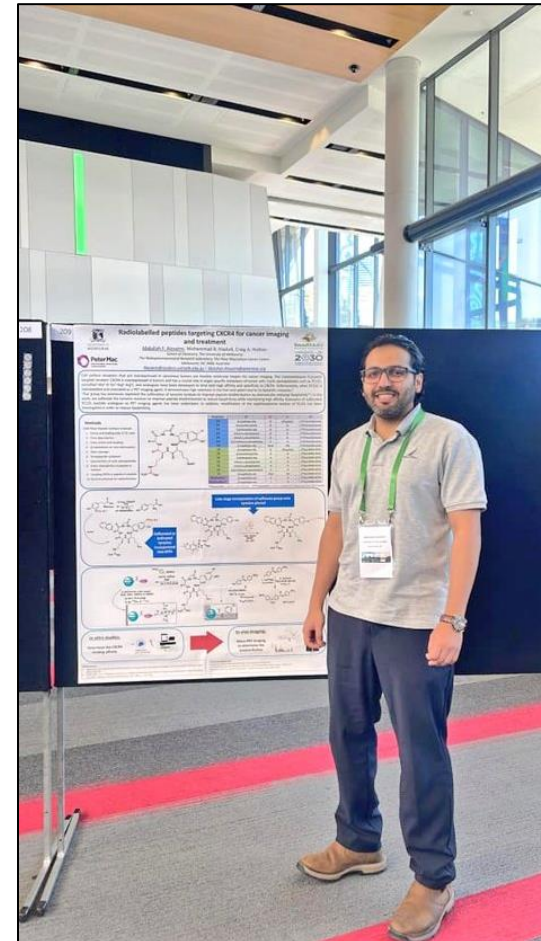
Late-stage incorporation of sulfonate group onto tyrosine phenol

In-vitro studies: Determine the CXCR4 binding affinity

In-vivo imaging: Micro-PET imaging to determine the biodistribution

References:
 1. Wang, J., et al. Detecting the CXCR4 expression in lymphomathorax disease by targeted nuclear imaging. *Techniques*, 2013.
 2. Wang, J., et al. Labeling and biodistribution of a novel CXCR4-targeting peptide. *Journal of Nuclear Medicine*, 2013.
 3. Wang, J., et al. Labeling and biodistribution of a novel CXCR4-targeting peptide. *Journal of Nuclear Medicine*, 2013.

Acknowledgments:
 The authors would like to thank the Australian Government for their support of this research through the Australian Government Research Infrastructure Support Scheme (ARISA) and the Peter MacCallum Cancer Centre, Melbourne.



أقامت الكلية ممثلة بوحدة الأنشطة الطلابية بطولة (سعادة عميد الكلية لكرة الطائرة) بين أقسام الكلية وأعضاء هيئة التدريس والموظفين. وقد جاءت المراكز الأولى في البطولة على النحو التالي :

- ١- فريق قسم علوم الأشعة والتصوير الطبي
- ٢- فريق أعضاء هيئة التدريس
- ٣- فريق قسم العلاج الطبيعي

