



انجازات قسم علوم الأشعة والتصوير الطبي

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 فراخ 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
New Australian Cancer Centre
Peter MacCallum Cancer Centre

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[His¹-Gly²-D-Tyr³-Arg⁴-Arg⁵], 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-CFC 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-Boc 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	R ⁵
1A	(2-naphthyl)-L-Ala	H	H	H	H
2A	(2-benzothiazyl)-L-Ala	H	H	H	H
3A	3-(4-Phenyl)-L-Ala	H	H	H	H
4A	4-Fluoro-L-phenylalanine	H	H	H	H
5A	5-Fluoro-L-phenylalanine	H	H	H	H
6A	3,4,5-Trifluoro-L-phenylalanine	H	H	H	H
7A	(2-naphthyl)-L-Ala	SO ₃ H	OH	H	H
1B	(2-naphthyl)-L-Ala	H	H	H	H
2B	(2-benzothiazyl)-L-Ala	H	H	H	H
3B	3-(4-Phenyl)-L-Ala	H	H	H	H
4B	4-Fluoro-L-phenylalanine	H	H	H	H
5B	5-Fluoro-L-phenylalanine	H	H	H	H
6B	3,4,5-Trifluoro-L-phenylalanine	H	H	H	H
7B	(2-naphthyl)-L-Ala	SO ₃ H	OH	H	H
PeptideA ³	(2-naphthyl)-L-Ala	H	H	H	H
PeptideB ³	(2-naphthyl)-L-Ala	H	H	H	H

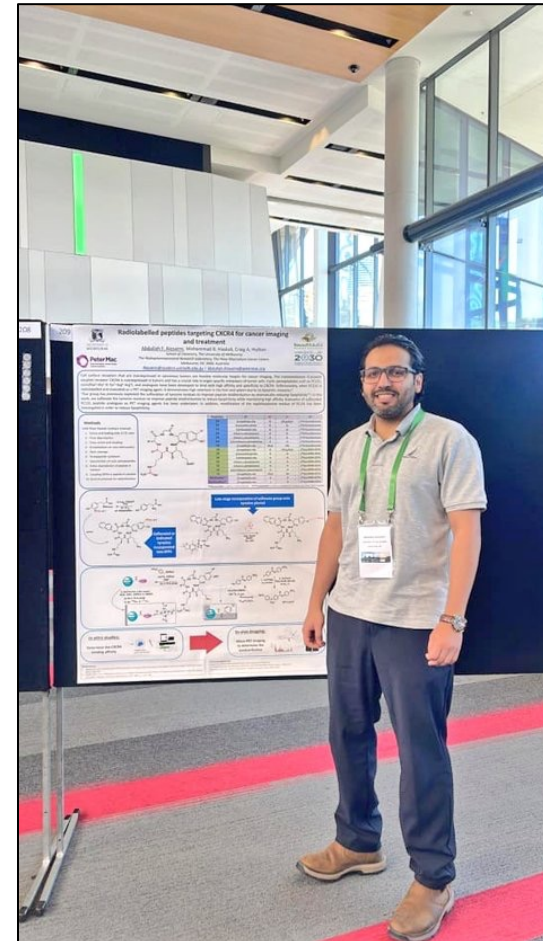
Sulfonated or iodinated tyrosine incorporated into SPPS

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. Hutton, C. A., et al. "Studying the CXCR4 expression in lymphomatoxic strains by targeted nuclear imaging." *Techniques*, 2013.
2. Hutton, C. A., et al. "Development of a novel tyrosine sulfonated peptide-based radiolabelled agent for PET imaging." *Journal of Nuclear Medicine*, 2013.
3. Hutton, C. A., et al. "Development of a novel tyrosine sulfonated peptide-based radiolabelled agent for PET imaging." *Journal of Nuclear Medicine*, 2013.



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



فوز الطالبة / سما عبدالله المنعم في ملتقى المشروعات الطلابية المتميزة للعام ١٤٤٥ هـ / ٢٠٢٤ م

شَكَرْتِكِ يَا رَبِّ



تتقدم وكالة الشؤون التعليمية بجامعة المجمعة بخالص الشكر والتقدير
للتالبة / سما عبدالله المنعم من كلية العلوم الطبية التطبيقية

لفوز مشروعها في ملتقى المشروعات الطلابية المتميزة
للعام الجامعي 1445 هـ / 2024 م

راجين الله تعالى أن يبارك في جهودها

وكيل الجامعة للشؤون التعليمية

أ.د محمد بن صالح العبودي