

新規アプリアトキシン誘導体およびそれを含有する抗がん剤（U582）

本発明の実用化・産業応用を目指して、技術移転を受けて頂く企業様を求めます

Description

天然物由来の化合物で、発がんプロモーション活性が低いPKCリガンドは、アメリカでPhase IIの臨床試験が行われているBryostatinsのみである。しかし、Bryo-1は天然物からの収率の低さや、合成の複雑さから、実用化には至っていない。

京都大学の入江教授らは、天然に存在するaplysiatoxin (ATX)から新規のATX誘導体を合成した。

本誘導体は、アポトーシスに関与しているPKC δ にBryo-1と同等程度に極めて高い結合能を有するにも関わらず、Bryo-1よりも顕著に高い細胞増殖抑制活性を示す。これは、本ATX誘導体のがん細胞増殖抑制機構にPKC δ 以外の標的分子が関与していることを示唆している。

Advantage

- ① novel PKCアイソザイム (δ , ϵ , η , θ) に対する高い結合選択性
- ② 高いヒトがん細胞増殖抑制活性
- ③ 合成工程数が少なく、容易な合成経路
- ④ 抗エイズ剤や抗アルツハイマー病薬としての効果も期待

Table1: Growth inhibition against human cancer cell lines

Cell lines	log GI ₅₀ (log M)	
	Bryo-1	ATX誘導体
HBC-4 (breast)	NT	-7.48
MDA-MB-231 (breast)	-5.10	-6.90
HCC2998 (colon)	-5.30	-6.47
NCI-H460 (lung)	-5.60	-7.07
A549 (lung)	-5.20	-6.01

Business Model

研究室において活性部位の特定、基本的な性能評価はできている。

今後は、本発明の実用化・医薬品化を目指して、技術移転を受けて頂く企業様を求める。

【実用化例】

1. 乳がん・肺がん・結腸がんに対する治療薬
2. 抗エイズ薬
3. 抗アルツハイマー薬

Patent

特願 2012-XXXXXX

【発明の名称】 新規アプリアトキシン誘導体及びそれを含有する抗がん剤

【発明者】 入江 一浩 他

【出願人】 国立大学法人京都大学

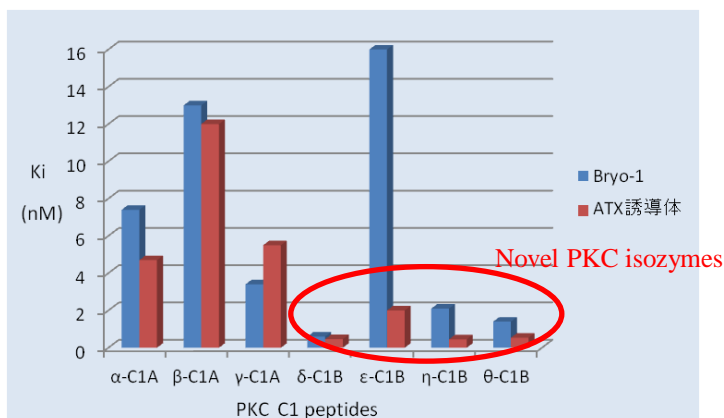
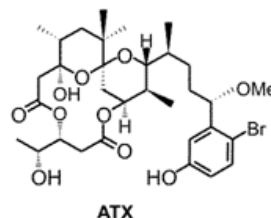


Fig. Ki Values of Inhibition of [³H] PDBu's binding

関西ティー・エル・オー(株)

Kansai Technology Licensing Organization



Contact

〒606-8501 京都市左京区吉田本町
 京都大学 産官学連携本部内 関西TLO(株)
 TEL (075)753-9150 / (075)353-5890
 E-mail : tlo@kansai-tlo.co.jp