

課題番号: **LS061**
助成額: 166 百万円

ライフ・イノベーション

生物・医学系

平成 23 年 2 月 10 日
～平成 26 年 3 月 31 日

革新的分子標的薬創製を志向した真の“天然物創薬フロンティア研究”

掛谷 秀昭 京都大学大学院薬学研究科 教授
Hideaki Kakeya



専門分野

ケミカルバイオロジー
天然物化学

キーワード

天然物有機化学／ケミカルバイオロジー／分子標的治療／生物活性物質／分子標的薬／天然物創薬／ケミカルジェネティクス

WEB ページ

<http://www.pharm.kyoto-u.ac.jp/sc-molsci/>

研究背景

高齢化社会において、がんや心不全をはじめとした多因子疾患の新しい治療薬・予防薬のリード化合物の開発が希求されている。また、生物活性小分子の標的タンパク質や標的シグナルパスウェイの発見は、対象疾患の治療標的となりうるために、生物活性小分子の標的タンパク質を迅速に同定する技術開発が希求されている。

研究目的

がん特異的微小環境および心不全発症機構などを制御標的とした新規天然有機分子の開拓・創製・薬理活性評価を基軸としたオリジナリティーの高い生理活性小分子の開発、ならびにケミカルジェネティクスの手法を基盤にした生理活性小分子—結合タンパク質(標的タンパク質)の迅速な解析・同定システムの構築を目指す。

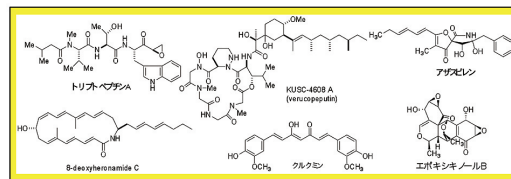
実績

代表論文:
Bioorg. Med. Chem. Lett., 23, 1608-1611, (2013)
J. Am. Chem. Soc., 136, 5209-5212, (2014)
特許出願: 特願 2012-250490、特願 2012-170361
受賞: バイオビジネスアワード JAPAN バイオ先端知賞・大阪府 (2013 年 2 月)
新聞: 日刊工業新聞朝刊「京大など、海洋微生物の抗真菌作用解明—抗がん創薬開発に道」(2014 年 4 月 3 日)
特記事項: 本研究課題を実施した大学院生等が、日本薬学会 134 年会(2014 年 3 月)、第 5 回食品薬学シンポジウム(2013 年 11 月)などで優秀発表賞を受賞した。

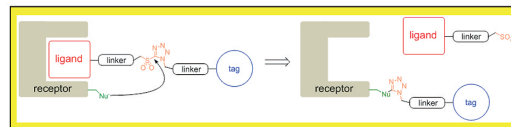
研究成果

有用な天然有機分子の開拓・創製・先導的ケミカルバイオロジー研究に成功

がん特異的微小環境および心不全発症機構などを標的として、独創性の高い“天然物創薬フロンティア研究”の遂行により、複数の創薬リード化合物の開発、治療標的タンパク質・標的パスウェイの解明に成功した。



有用な天然有機分子の開拓・創製・先導的ケミカルバイオロジー研究



5-sulfonyl tetrazole 基を利用した 5-SOxT プローブ法の開発

2013 年の応用展開

本研究課題で開拓した天然有機分子は、がんや心不全などの多因子疾患に対する治療薬・予防薬のリード化合物としての貢献が期待される。また、生理活性小分子の結合タンパク

ケミカルジェネティクスの手法を基盤とした生理活性小分子—結合タンパク質の解析・同定システムの確立

標的未知の生理活性小分子の結合タンパク質(標的タンパク質)の探索・同定のための画期的なプラットフォームの開発に成功した。

質探索・同定システムである 5-SOxT プローブ法等は、薬剤の対象疾患における治療標的タンパク質・標的パスウェイの迅速な発見への貢献が期待される。