

## 平成 19 年度顕在化ステージ 事後評価報告書

シーズ顕在化プロデューサー所属機関名:日東化成株式会社

研究リーダー所属機関名 :大阪大学

課題名:創薬標的RNAに結合するドラッグ候補化合物のハイスループットスクリーニング法開発

### 1. 顕在化ステージの目的

標的 RNA に対して創薬企業のニーズに合致した結合強度、結合特性をもつ創薬候補化合物の一次スクリーニングを実現するハイスループットスクリーニング法を提案した。さらに、本研究に先立って出願した特許実施例の追加とスクリーニングに必要な物質の性能向上と、キサンテン以外の周辺誘導体の調査による X2S を補完あるいは凌駕する蛍光特性を示す新たな化合物群の探索である。

### 2. 成果の概要 ※研究実施者の完了報告書より抜粋

#### ○大学の研究成果

ヒト免疫不全ウイルス HIV-1 mRNA の核外輸送に必須な部分構造 RRE と RRE に結合する Rev タンパクの部分構造 Rev ペプチドの相互作用をスクリーニングのポジティブコントロールとして用い、提案したライブラリーからのハイスループットスクリーニング手法の実証実験を行い、その有効性を確認した。先に出願した特許出願の権利を拡大、強化した PCT 出願を果たした。今後、企業との共同研究を視野に入れ、ポストゲノムの RNA を標的とした創薬研究を推進するツールとして、さらに開発を続ける予定である。

#### ○企業の研究成果

ハイスループットに RNA と低分子の相互作用を見いだすために用いる化合物の設計、合成を行い、当初予定していた化合物をその性能評価に供することが出来た。

### 3. 総合所見

6種類の X2S 誘導体の合成、蛍光特性評価およびその PCT 出願による権利化拡大など、一定の成果が得られた。また、化合物ライブラリーからのスクリーニングでヒットする化合物も得られている。その結果次第で、今後、幅広い検討が必要になってくるが、実用化が期待される。