

研究成果展開事業 研究成果最適展開支援プログラム
FS ステージ シーズ顕在化タイプ 事後評価報告書

研究開発課題名	: TGF- β 及びMMP9転写前阻害点眼剤の開発
プロジェクトリーダー	: わかもと製薬(株)
所属機関	: わかもと製薬(株)
研究責任者	: 永瀬浩喜(千葉県がんセンター)

1. 研究開発の目的

眼科領域の感染や外傷、手術による線維化や炎症状態は後天的な視力障害という社会的問題を引き起こす。本研究は、DNA 認識化合物を用いた点眼剤治療法を開発し、病変部特異的にゲノム制御系を変化させ病因遺伝子の発現を調節することで炎症細胞などの増殖性、浸潤性等を抑制する治療法を開発し、この問題を解決する。TGF- β と MMP9 を標的とする化合物による点眼治療法の特許化、動物実験による効果を確認している。本研究課題では、ヒトに対する候補化合物を合成し、GMP レベルでの大量合成法を開発し、リードコンパウンドを合成、その薬効や物性・毒性試験を行い、GMP・GLP グレードの前臨床試験、臨床試験に向けたステップを進めることを目的とした。

2. 研究開発の概要

①成果

1. ポリアミド合成法の開発 及び 2. リード化合物候補の同定 を行い、眼科治療薬の候補を創出し、合成法を確立した。さらにスケールアップした効率の良い大量合成法の確立が必要である。

②今後の展開

リード化合物候補の企業における検討を行い、点眼薬としての産業化を目指す。本薬剤は、医療技術の進歩や薬剤の開発により改善はみられているものの、特に病巣が広範囲に及ぶ場合、未だ有効な治療法がない角膜障害の症例に対するアンメットな領域への予防的に使用できる点眼治療薬を提供する。さらに強い抗炎症作用によりステロイド製剤に変わる治療薬を提供する。

3. 総合所見

今後の取り組み次第でイノベーション創出の期待はある。当初の目標であった「GMP レベルでの大量合成法を開発し、リードコンパウンドを合成、その薬効や物性・毒性試験を行う」ことに関してはほとんど未達であり顕在化は不十分であるが、研究のストラテジーには期待が持たれる。

早期のリード化合物の選定と、in vivo 実験系における薬理効果の評価が待たれる。困難なテーマであることが予想されるが、今後期待したい。