

研究成果展開事業 研究成果最適展開支援プログラム
産学共同<育成型> 事後評価報告書

研究開発課題名	: 生体内で安定な水溶性標識基による生体機能性アスタチン標識化合物の合成と機能評価
プロジェクトリーダー (研究責任者)	: 田中 浩士(国立大学法人東京工業大学)

I. 研究開発の目的

本課題は「生体内で安定な水溶性標識基によるアスタチン標識化合物の合成法の開発と機能評価」と題して、独自に開発したネオペンチル標識基を利用した標的 α 線治療に用いるアスタチン標識分子の合成法の開発とその機能評価を行う。本標識基は従来のアスタチン標識基とは異なり、生体内で脱アスタチン化が進行しないため体内動態制御が可能であり、水溶性であるため生体分子への非特異的結合による集積を生じさせない。また、他の放射性ハロゲンによる標識も可能であるため、ターゲットに応じたラジオセラノスティクス薬の開発を可能にする。さらに、自動合成装置を用いた標識技術を開発することにより、社会実装を目指す。

II. 研究開発の概要

① 実施概要

本研究開発では、独自に開発したネオペンチル標識基を利用した標的 α 線治療に用いるアスタチン標識化合物の合成法の開発とその機能評価を行った。まず、新規な標識前駆体を利用する効率的なアスタチン標識化法の開発とその自動化を達成した。続いて、生物機能性ベンジルグアニジンおよび非対称ウレア PSMA リガンドのアスタチン標識を行うことにより、本標識化の高い官能基共存性を実証した。さらに、非対称ウレア誘導体については、対応する放射性ヨウ素誘導体と体内動態の比較を行い、アスタチン標識化合物が生体内で安定に存在することを確認した。これにより、アスタチン標識化合物の合成に関する標識化学の基盤を確立した。

② 今後の展開

今後は、本研究開発を基盤技術として立ち上げたベンチャー企業 (NeoP Tech) を核として、標識試薬類の社会実装を目指す。さらに、アカデミアとの連携により新しい生物機能性放射性標識治療薬・診断薬の開発、およびそれらの製薬会社への橋渡しを行っていく。また、標識化合物合成を効率化するインフラ技術の開発を行い、ソフトおよびハードの両面で放射性医薬品の創薬エコシステムの確立に貢献する。

III. 総合所見

目標を達成し、次の研究開発フェーズ移行に必要な成果が得られた。

クロロホルムフリーネオペンチルアスタチン標識法によるモデル標識前駆体合成用アミド化試薬の合成に成功しており、要素技術に関する研究開発目標は達成している。これらの成果などを基にスタートアップ企業を設立し、放射性医薬品開発の創薬エコシステム確立を目指した活動へと繋げたことに意義がある。