# 新規SN-38誘導体

# ~抗腫瘍活性と安全性を最大限高めたナノキャリアフリープロドラッグ~

# 発明のポイント

- 腫瘍に多く存在するグルタチオン(GSH)の還元能を利用したプロドラッグ
- 薬剤自体をナノ粒子化することによりナノキャリアフリーを実現したDDS設計



高い抗腫瘍活性と安全性を実現 (医師主導治験に向けて準備中)

#### 【既存のナノキャリアとプロドラッグの短所】

- ◎ ナノキャリア (LNP等)
  - ・ 肝臓集積性が高い (>90%)
  - ・ 有効成分の担持率が低い(<10%)
  - 担体(有効成分以外)による副作用
- ◎ プロドラッグ
  - ・ 標的細胞到達前の代謝による薬効低下と副作用

# 【SN-38誘導体の特長】

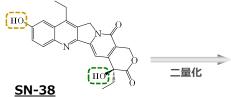
標的細胞集積性が高い

有効成分の担持率が高い

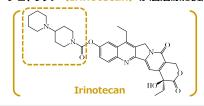
有効成分自体をナノ粒子化(担体が存在しない)

・ 標的細胞到達前には代謝を受けにくい(GSHにより代謝)

## 発明の概要



- ・トポイソメラーゼ阻害剤
- ・難水溶性(水溶解度: <5 ppm)
- ・プロドラッグ(Irinotecan)が癌治療に使用





### SN-38誘導体 (SN-38 SSリンカー二量体)

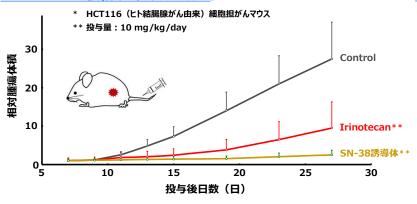
- ・SS結合を含むリンカー (SSリンカー)を介したSN-38二量体
- ・GSHのSS結合切断能(還元能)を利用したプロドラッグ
- ・正常細胞ではGSHが少ないため、正常細胞への影響は低い

高い分散安定性

# 従来技術との比較・優位性

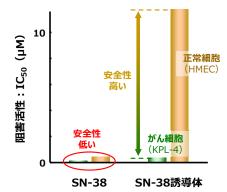
### 【本技術と従来技術の薬効・安全性比較】

a. in vivo試験結果 (マウス\*、静注)



SN-38誘導体はIrinotecanに比べ、抗腫瘍活性が高い

#### b. 安全性比較 (SN-38 vs. SN-38誘導体)



SN-38誘導体はSN-38に比べ、 安全性が高い

# 想定される用途

◎ 新規抗がん剤 (肺がん、乳がん、大腸がん、子宮頸がん、胃がんなど向け) の開発

#### 代表発明者: ライセンス可能な特許

発明の名称 SN-38誘導体、当該誘導体を含むナノ粒子、 笠井 均(東北大学・教授)

医薬及び当該ナノ粒子の製造方法

国際公開番号 WO2022190626 共同発明者:

小関 良卓 (東北大学・助教) 連 絡 先 JST知的財産マネジメント推進部 ライセンス担当

電話) 03-5214-8486 メール) license@jst.go.jp

www.jst.go.jp/chizai/



他