

## 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：株式会社ミッド研究所

研究リーダー所属機関名：大阪大学

課題名：生物製剤と糖鎖の PET イメージングを利用した新規医療診断システムと創薬への展開

### 1. 顕在化ステージの目的

本課題では、( i )短寿命放射性原子を極微量のペプチド、タンパク質、モノクロナール抗体、あるいは糖鎖クラスターや糖ペプチドに対して効率的かつ迅速に、そして誰もが簡単に標識化できる(汎用化)技術を開発することを目的とする。さらに高速標識化技術を用いて、( ii )様々な生体分子の PET イメージングを簡便に実現し、生物製剤をベースとする医療診断システムや創薬の過程において鍵となる方法論にまで確立することを目的とする。

### 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

PET、MRI、または蛍光イメージングに有効な高速標識プローブの効率的な供給法を開発した。ペプチド、タンパク質などのアミノ基に対して、サブナノグラムスケールでの標識化を達成し、動物モデルを用いたイメージングを実現した。さらに、エッペンドルフ内での簡便標識キットを開発した。一方、末端にアセチレンを持つポリリジン型 dendrimer に対して、Cu( I )/ヒスチジンを新たな活性化剤とするクリック反応を行うことにより、様々な糖鎖構造を導入できる方法論を確立した。さらに得られる糖鎖クラスターに対して、上記で開発した高速標識プローブ、および<sup>68</sup>Ga を作用させることにより、糖鎖クラスターPET プローブを開発した。

#### ○企業の研究成果

大阪大学での標識化プローブ合成研究を基にして、数十グラムのプローブの供給を実現した。また、DOTA や様々な蛍光基導入のためのプローブを含め、将来的に 50~100 種類の供給と市場販売が可能となった。簡易キットとして開発した各種蛍光標識化プローブは、既に各イメージング機関へその効率性評価を依頼し、H21 年早々の販売に向けて始動した。また、イメージング関連機関や製薬企業から提出された様々な生物製剤サンプルの標識化およびその標識サンプルのスクリーニングを直ちに受注できるよう体制を整えた。一方、大阪大学で実現した糖鎖クラスターPET プローブの開発を基に、PET ターゲティングおよびスクリーニングを実施する体制を整えた。

### 3. 総合所見

糖鎖標識プローブ、高速標識化プローブおよび標識化キットを開発し、概ね期待通りの成果が得られている。例えば、糖鎖標識技術はガンなどの分子イメージングには必須の技術であり、応用分野は広くイノベーション創出が期待される。