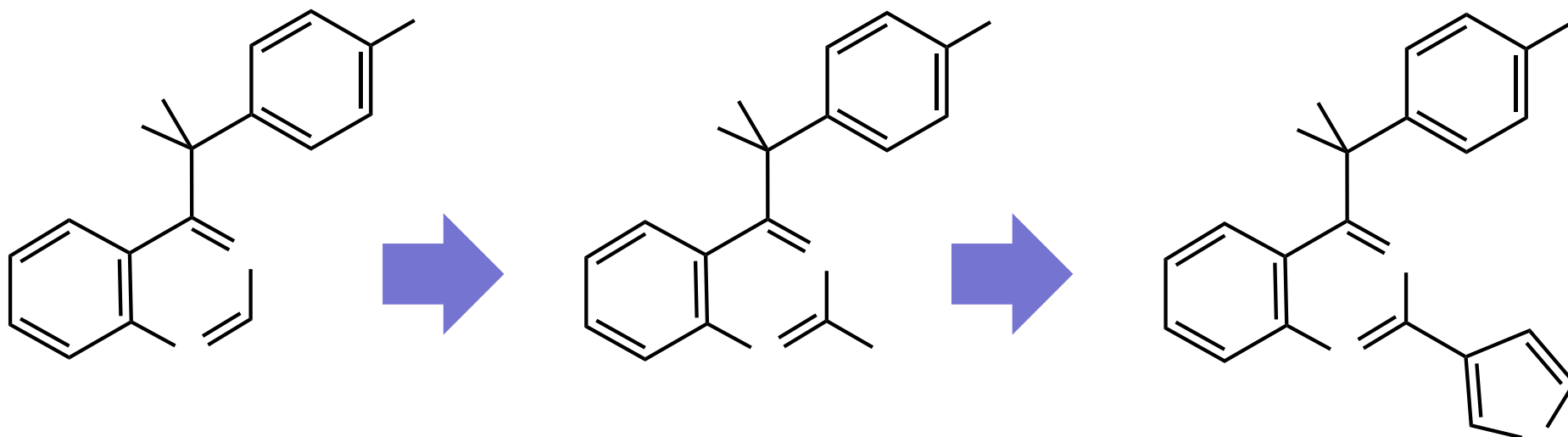


がん細胞の増殖を阻害する 蛍光性分子

上智大学 理工学部 物質生命理工学科
准教授 鈴木由美子

2019年9月12日

抗がん性をもつ新規化合物の発見



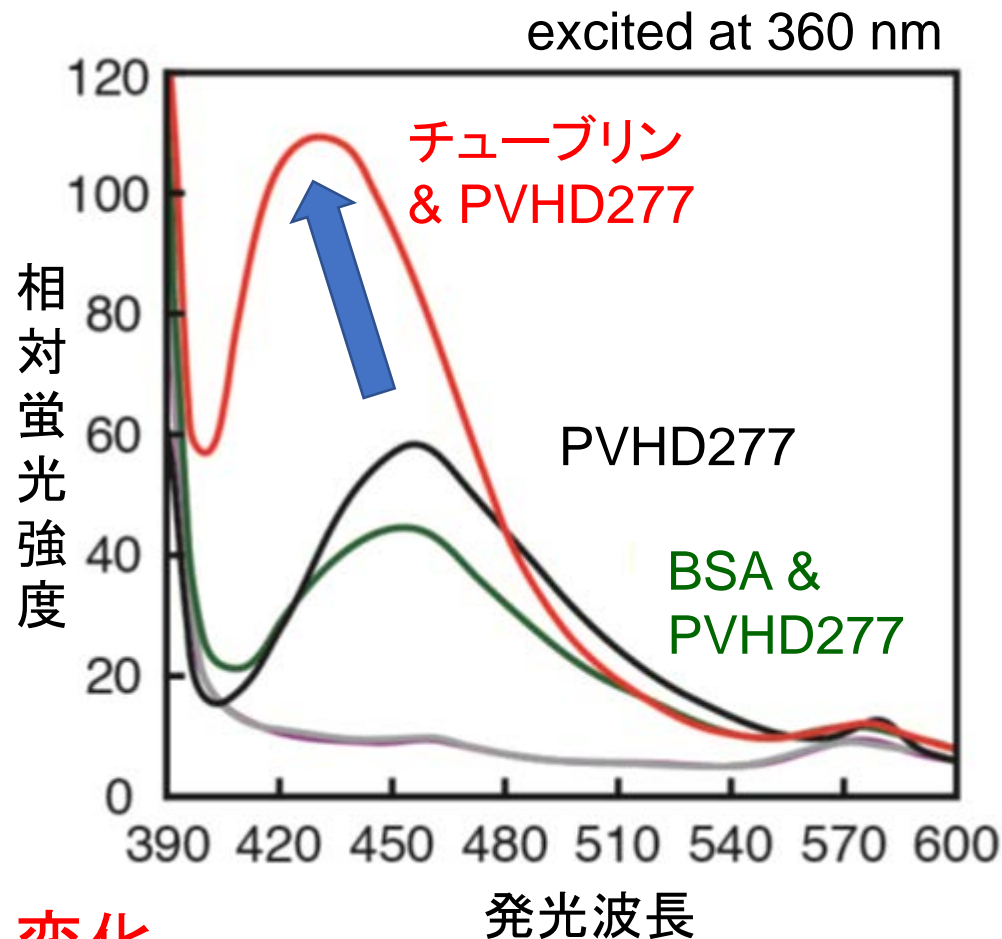
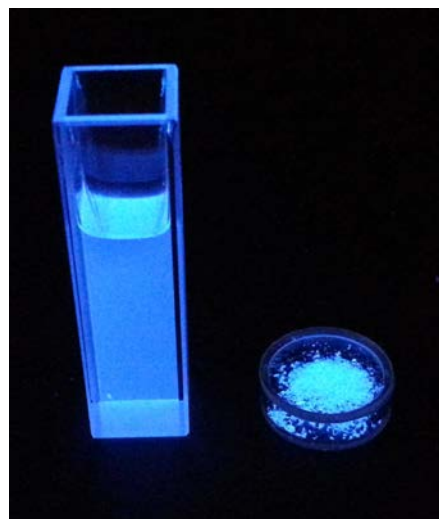
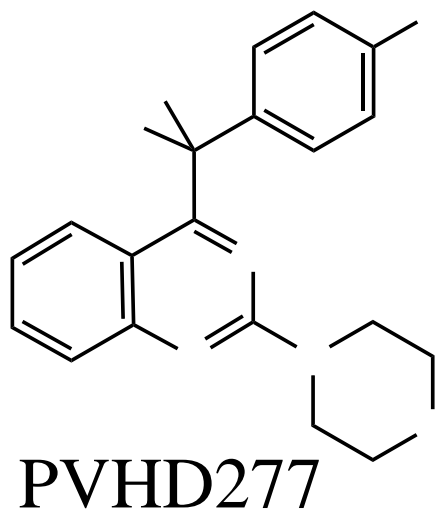
リード化合物

誘導体の合成
活性増強

市販抗がん剤に
匹敵する活性

簡便な合成(4~5段階)

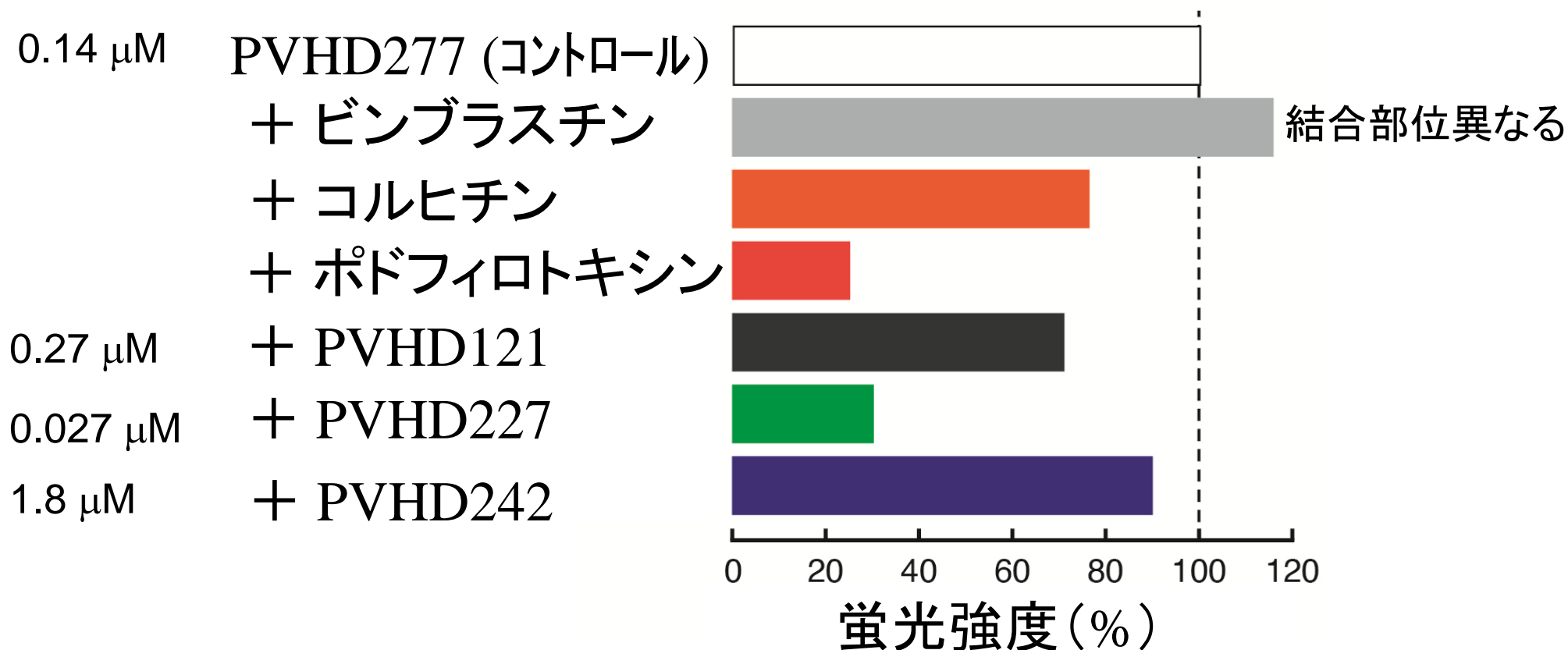
蛍光性・抗がん活性化化合物の発見



- 固体・溶液ともに蛍光性
- チューブリンと結合 → 波長変化
蛍光増大

蛍光性の利用：受容体競合結合試験

IC₅₀
(肺がん細胞 A549)



抗がん活性と蛍光強度に相関



簡易的アッセイ

蛍光性の利用：細胞内分布の観察

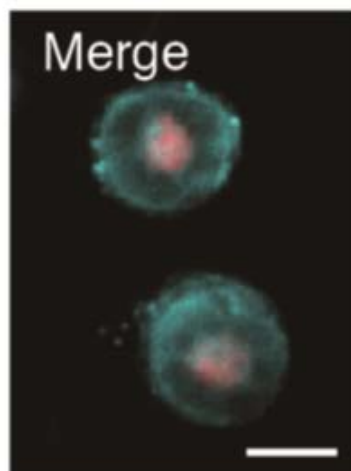
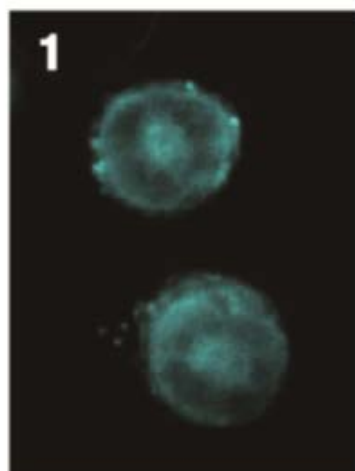
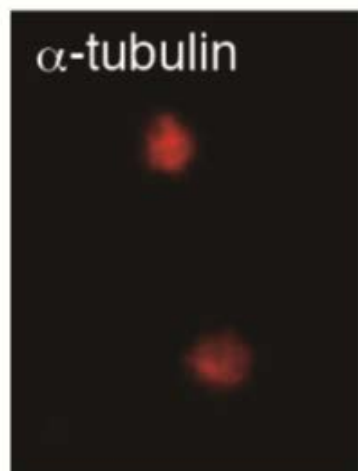
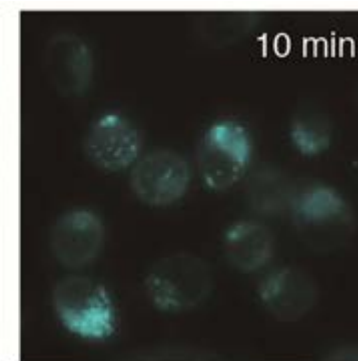
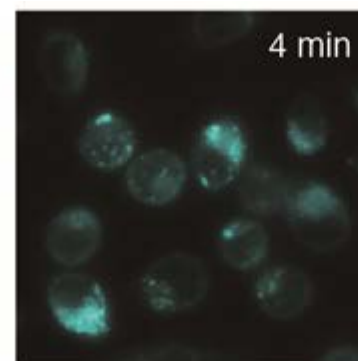
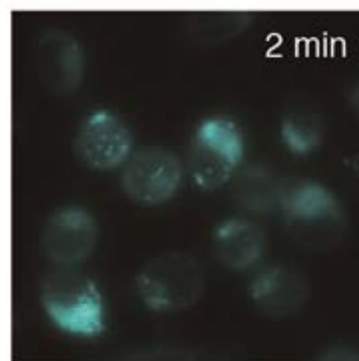
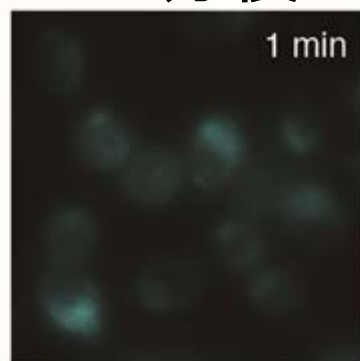
添加前

1分後

2分後

4分後

10分後



- 速やかな細胞内取り込み
- チューブリン・細胞膜内側
周辺に分布

赤：チューブリン， 水色：PVHD277

従来技術とその問題点

従来のがん治療法としては、外科手術、放射線治療法、化学療法その他、4番目の柱として免疫療法が注目されているが、

高額な医療費

効果の範囲が限られる

等の問題があり、新たな抗がん剤が今もなお求められている。

新技術の特徴・従来技術との比較

- 単工程で合成できる。
- 既存薬(タキソール)と同程度の高活性をもつ。
- 蛍光性を利用して体内動態を簡単に観測可。
- 細胞内へ速やかに取り込まれる。

想定される用途

- 医療における、抗がん治療薬として。
- 生物科学研究において、チューブリン阻害剤試薬として。
- 生物科学研究における、蛍光性試薬として。

実用化に向けた課題

- 抗がんの作用機序が解明されていない。
- 選択性や毒性の評価が十分でない。
- 各鏡像異性体を効率的に作り分ける方法が確立されていない。

企業への期待

- 抗がん作用機序の解明を目指した共同研究を希望。
- 抗がん剤および生化学用試薬の開発研究を行っている企業には、本技術の導入が有効と思われる。

本技術に関する知的財産権

- 発明の名称 : キナゾリン化合物を有効成分とする医薬組成物
- 出願番号 : 特願2010-046911
- 出願人 : 一般社団法人ファルマバレープロジェクト支援機構
- 発明者 : 浅井章良、澤田潤一、松野研司、鈴木由美子

お問い合わせ先

上智大学

学術情報局 研究推進センター

TEL 03-3238-3173

FAX 03-3238-4116

e-mail g_rant-co@sophia.ac.jp