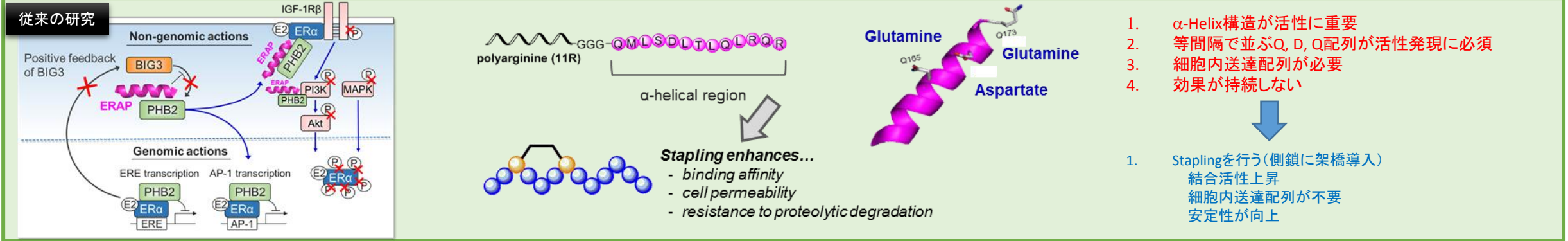


# 重点クラスター 中分子創薬シード展開クラスター

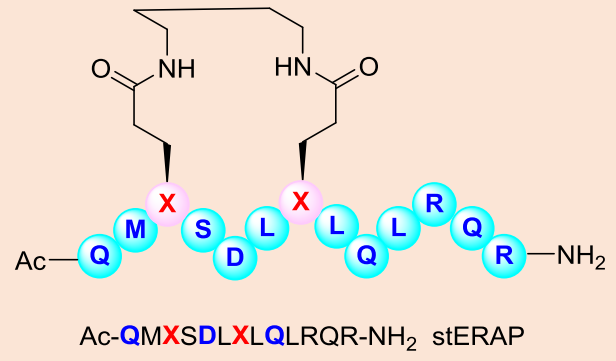
代表 大高 章、片桐豊雅、南川典昭、石田竜弘、重永 章、吉丸哲郎

**研究の概要:** 中分子創薬シードである乳がん抑制ペプチドERAP(片桐ら)に関し、革新的特色研究(代表 南川)により創薬展開基盤研究を推進してきた。マウスレベルで有望な物質(stERAP)を見出すに至ったので、新たな創薬概念の創出、前臨床に向けた化合物大量供給体制の確立、薬物動態学的性質の改善に向け研究をさらに推進する。

**研究の必要性:** 高活性化合物取得を第一義とする点が大学発創薬の問題点である。化合物の高活性化や新規性以外にも、実際の創薬では新たな創薬概念の創出、化合物大量供給体制の確立、薬物動態の改良が必須の項目である。創薬シードとして有望なERAPを題材とし、これら課題に挑み、ERAPの創薬展開に資する本研究は、一つのモデルケースとして徳島大学における将来のアカデミア創薬の基盤形成に極めて重要なものとなる。



## 研究計画1 合成化学から アミノ酸置換



アミノ酸置換による活性・安定性評価

## 研究計画2 合成化学から 前臨床に向けた化合物合成の検討

- ✓ 現在利用している固相合成法では達成困難
- ✓ 液相合成法は熟練の技が必要

- 大量合成手法の確立なくして実用化への道はない
- 味の素開発のAJIPHASE法の利用を検討
- 合成ノウハウについては味の素から入手可能

検討を開始