

# 抗がん剤デリバリー小分子の創製

Development of small molecule-based anticancer drug delivery systems

#### 研究分野 Department

#### 複合分子化学

Complex molecular chemistry



鈴木孝禎 T. Suzuki



ドラッグデリバリー、抗がん剤、小分子 drug delivery, anticancer agents, small molecules



#### 医薬品、生物試験用試薬

therapeutic agents, reagents for biological studies

## 研究開発段階



実用化準備



これまでのドラッグデリバリーシステム (DDS) はがん選択性を示す一方で、その多くに、大きな分子に由来した低い体内動態や高い生産コスト等の課題が残されています。これらの課題を解決するために、小分子型DDSの開発が望まれています。

#### 概要•特徵

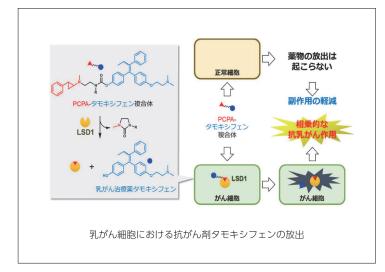
がん細胞に過剰発現するリシン特異的脱メチル化酵素LSD1に結合することで、がん細胞選択的に抗がん剤を放出する小分子を創製しました。

### 技術内容

- ●多くのがん細胞に高発現するLSD1の阻害を引き金に、抗がん剤を放出する小分子を開発。
- がん細胞選択的な薬物放出を可能にし、抗が ん剤に由来する副作用の軽減が期待される。
- ●多くの抗がん剤のデリバリーに応用することが 可能
- ●現在高分子型ドラッグデリバリーで問題になっている低い体内動態や高コスト、副作用が、本分子技術により改善できると期待される。

#### 社会への影響・期待される効果

LSD1を高発現するがん細胞で選択的に薬物を放出する方法が開発されました。すでに、動物実験での効果や安全性が確認されており、今



後、臨床への応用を進めていくことにより、副作用の少ない抗乳がん剤の開発が期待されます。

また、本分子技術は、乳がん剤タモキシフェンだけでなく、他の多くの抗がん剤や毒性化合物に適応することが可能であり、新たな抗がんデリバリー分子の開発に活用されることが期待されます。

#### 【論文 Paper】

- [1] Chem. Pharm. Bull. 66 (2019) 192–195
- [2] Chem. Rec. 18 (2018) 1782-1791
- [3] Angew. Chem. Int. Ed. 55 (2016) 16115-16118.
- [4] Angew. Chem. Int. Ed. 52 (2013) 8620-8624.

#### 【特許 Patent】

[1] 特願2015-198860 「抗がん剤デリバリー分子」