



## 前立腺癌治療薬の創成

新しい作用機構の前立腺癌治療薬の創成

技術分野分類 6104: 生物生産化学・生物有機化学 6804: 創薬化学

技術キーワード F: 合成 B: 医薬分子設計

産業分類 P-83: 医療業

内 容	概 要	分子内 <i>ipso</i> -置換法によるフラボン骨格の新規構築法を見だし、前立腺癌治療薬として期待される新規多置換型フラボン誘導体を STERIMOL パラメーター等を考慮して合成した。
	従来技術・ 競合技術 との比較 (優位性)	前立腺癌治療薬として期待される多置換フラボン誘導体を STERIMOL パラメーター等を考慮して分子設計し合成した。その結果、創薬リード化合物となり得る新規化合物（新規多置換型フラボン誘導体）を見いだした。
	本技術の 有用性	新規化合物の特徴は以下の通りである。○レポーターアッセイと細胞増殖抑制作用の強度は Bicalutamide と同程度。OAR の転写活性を抑制し、DHT 刺激による LNCaP 細胞の増殖を抑制する。OAR への直接の結合作用は弱く、上記活性は受容体変異の影響が無い。○他の癌細胞増殖への影響が少ない点から、AR のシグナルに作用することで上記活性を発揮している可能性が考えられる。
関連情報 (図・表・写真等)		<p>Substituent constants (<math>\sigma</math>)<sup>a</sup> STERIMOL parameter<sup>b</sup></p> <p><sup>a</sup>Substituent constant: Hammett L. P., <i>Chem. Rev.</i>, 17, 125-136 (1935).  <sup>b</sup>STERIMOL parameter: Hansch C., Leo A., et. al. <i>J. Med. Chem.</i> 16, 1207-1216 (1973).</p> <p>R<sup>1</sup> = OH; R<sup>2</sup> = CN</p> <p>Chem. Pharm. Bull., 58, 1107 (2010).</p>
適用可能製品		アンドロゲンの変異受容体にも効果のある前立腺癌治療薬
技術 シース 保有者	氏名 所属・役職	松儀 真人 (まつぎ まさと) 名城大学 農学部 応用生物化学科 教授
技術 シース 照会先	窓口 TEL/FAX e-mail	名城大学 学術研究支援センター 052-838-2036/052-833-7200 lsangaku@ccml.meijo-u.ac.jp

■知的財産 特開 2011-57574 アンドロゲン受容体アンタゴニスト及びアンドロゲン受容体結合阻害剤

■試作品状況 無 提示可 提供可

作成日 2012 年 10 月 19 日