

**創薬基盤推進研究事業 研究開発課題
事後評価報告書**

事業名 (年度)	創薬基盤推進研究事業 (平成30年度～令和4年度)
研究開発課題名	アプタマー情報をベースにした低分子医薬品創製プラットフォームの構築
代表機関名	国立研究開発法人医薬基盤・健康・栄養研究所
研究開発代表者名	笠原 勇矢

総合評価：良い

【評価コメント】

人工核酸アプタマーから作成したファーマコフォアによる新たな低分子化デザイン手法についての技術構築を着実に行った。IL-6R アプタマー構造に基づきシグナル制御可能な低分子候補化合物を効率的に見出し、核酸分解酵素を用いた人工核酸アプタマーの構造を推定するに至ったことは評価できる。

ただし、配列類似度の高いテンプレートの発掘段階に留まり、汎用性のある低分子医薬品創出技術としては達成できていない部分がある。特に、アプタマーと標的タンパク質との複合体構造予測が当初想定よりも非常に難しいことや、シード化合物の活性が設計元のアプタマーや抗体に比べて弱いことが判明しており、さらなる技術改良に向けて検討を継続していただきたい。今後、他の標的への適用可能性や汎用性を踏まえた検討を進め、広く活用される低分子化合物デザイン技術を完成されることを期待する。

以上