



DNW-26030 の概要

課題名 : 二系統カルバペネマーゼ阻害剤の探索

主任研究者 (Principal Investigator) :

和知野 純一 (学校法人藤田学園 藤田医科大学 医療科学部)

ステージ : 検証ステージⅢ

【標的疾患】

カルバペネマーゼ産生菌による敗血症などの重症感染症

【創薬標的】

メタロ型及びセリン型カルバペネマーゼ

【創薬コンセプト】

カルバペネマーゼを直接阻害する革新的阻害剤を開発する。本阻害剤をカルバペネム系抗菌薬と併用することで、これまで治療困難であったカルバペネマーゼ産生菌に対し、強力かつ実用的な治療選択肢を創出する。

【ターゲットプロダクトプロファイル】

メタロ型カルバペネマーゼ及びセリン型カルバペネマーゼを広範に阻害し、カルバペネム耐性グラム陰性菌（腸内細菌目細菌、緑膿菌及び *Acinetobacter* 属菌）による重症感染症に対して、カルバペネム系抗菌薬と併用投与する注射用β-ラクタマーゼ阻害剤。

【モダリティの設定】

低分子化合物

【創薬コンセプトの妥当性を支持するエビデンス】

以下のことが PI により明らかにされている。

平成 27 年度～平成 29 年度に実施した日本医療研究開発機構感染症研究国際展開戦略プログラム (J-GRID) において、

- 1) 広範囲多剤耐性菌が産生するカルバペネマーゼを阻害する低分子物質の探索を試み、カルバペネマーゼ阻害薬の候補物質を複数発見した。
- 2) 多剤耐性菌の生育を抑制する物質を探索し、数種類の抗菌性物質の候補を見出した。

以下のことが創薬ブースター支援により明らかにされている。

誘導体合成研究で得られている化合物は、臨床的に重要な複数のメタロ β ラクタマーゼに対して阻害活性を示すとともに、既存又は開発中の阻害剤と比較して競争力のある阻害活性を示す。さらに動物感染モデルにおいて有効性が確認されている。

【科学的、技術的な優位性】

メタロ型とセリン型カルバペネマーゼに対して阻害活性を持つリード候補化合物が得られている。

【支援ステージにおける目標】

企業導出できるポテンシャルを持つ化合物を創出する。

【関連特許】

なし

テーマに関するお問い合わせは下記までお寄せください。

Principal investigator へのお問い合わせはご遠慮くださるようお願いいたします。

(問合せ先)

国立研究開発法人日本医療研究開発機構 創薬事業部

E-mail : id3desk@amed.go.jp