

CAMD 報告会

(Center for Development of Advanced Medicine for Dementia)

創薬における“リード化合物の最適化”と “Phase IIでの attrition”に関して

治療薬探索研究部 医薬化合物開発室

河合 昭好 室長

平成 24 年 12 月 13 日(木) 16 時 00 分～

第一研究棟 2 階会議室

基礎研究と臨床研究を結ぶ創薬の重要なプロセスの1つに、“リード化合物の最適化”がある。この最適化プロセスは、リード化合物の薬効、薬物動態、安全性の問題点を改善し、臨床候補品を見出す上で必須のプロセスと言える。具体的には①リード化合物のどこに問題があるかをまず解析し、②その問題点を改善するための化合物をデザインし、③合成し、④スクリーニングするというサイクルを何度か回すことによって最適化して行くプロセスである。当センターでもアルツハイマー病治療薬の創製に向け HTS が動き出そうとしている今、その次のプロセスである“リード化合物の最適化”をどのように行うかについて、事例を交えて紹介したい。

また後半では、メガファーマを中心に大きな問題となっている R&D の生産性の低下、特に Phase II での attrition に焦点を当てたい。その attrition の主な原因は、薬物動態でも安全性でもなく、期待通りの薬効が得られないことにある。

この問題の要因と、アカデミアの果たす役割にも触れたい。