

旭化成ファーマ株式会社

AsahiKASEI

昨日まで世界になかったもの

旭化成ファーマは、創薬や技術研究のフィールドで、世界の”人びとの”いのち”と”暮らし”により広く、深く貢献したいと考えております。弊社は、国内外からの導入や提携を推進・強化をするために、前臨床段階までの新薬候補化合物や、創薬に関する最先端技術の導入、提携および共同研究などのオープンイノベーション活動を推進しています。

この度、国内の大学や研究機関、企業を対象として創薬に関する研究の公募を実施しますのでお知らせします。2020年1月7日14:00(日本標準時)～2020年2月6日17:00(日本標準時)を公募期間としております。詳細は下記の当社ウェブサイトをご覧ください。

<旭化成ファーマオープンイノベーション・公募サイト>

<https://www.asahikasei-pharma.co.jp/a-compass/jp/>

皆様のご応募をお待ち申し上げます。

## **旭化成ファーマが求める公募テーマ概要**

- 旭化成ファーマの注力領域における新規創薬シーズ・創薬技術シーズ
  - 疼痛・神経変性疾患領域
  - 自己免疫疾患領域
  - 救急領域
  - 骨・軟骨領域
  - 筋疾患領域
  
- 旭化成ファーマでの創薬研究の課題解決のための技術
  - 創薬基盤技術
  - 薬物動態関連技術
  - 製剤技術

各公募テーマの詳細な内容については、次ページ以降に記載しております。

お問い合わせ先：上記 HP の「お問い合わせ」よりご連絡ください。

## 旭化成ファーマ 公募テーマ

### 旭化成ファーマ注力領域における新規創薬シーズ・創薬技術シーズ

#### <疼痛・神経変性疾患領域>

##### 1.1 疼痛領域における新規創薬標的分子、又は医薬品候補物質

対象疾患：神経障害性疼痛、変形性膝関節痛、術後遷延性疼痛、がん性疼痛、腰痛  
ただし、オピオイド、NSAIDs は対象外

- ・ 新規性、有用性が高く、画期的新薬（First-in-class）となりうる標的分子が望ましく、Multi-target drug も可だが、複数薬剤の組み合わせは対象外とする
- ・ in vivo データ（遺伝子欠損マウスを用いた解析でも可）のあるものが望ましい  
SNP 等のヒトのエビデンスがあるものも評価の対象とする
- ・ 社内で検討済み、もしくは検討中の標的分子はお断りする場合があります

##### 1.2 神経細胞（後根神経節、脊髄後角神経等）あるいはグリア細胞（マイクログリア、アストロサイト等）を用いたフェノタイプアッセイ

- ・ 疼痛に関連するインプットおよびアウトプットで構築されていること  
ただし、炎症性疼痛（NSAIDs, COX2, プロスタグランジン等）に関連するインプット/アウトプットは除外とする
- ・ In vitro スクリーニング用（>96 Well）に、ある程度のスループットを確保できること
- ・ 神経細胞を用いる場合は、共培養系（後根神経節 - 脊髄後角神経、神経細胞 - グリア細胞）であること

##### 1.3 疼痛領域における次世代創薬技術

###### ① 脊髄への化合物輸送技術

- ・ 低分子化合物を脊髄選択的に輸送する方法
- ・ 経口投与可能な技術が望ましい

###### ② 中枢移行性の高いペプチド・抗体・タンパク質の取得技術

###### ③ 中枢に移行可能で、標的とするタンパク質量を選択的に減少させる技術

- ・ 低分子化合物による手法が望ましい

## 1.4 神経変性疾患領域の希少疾患における新規創薬標的分子、又は医薬品候補物質、創薬技術

### ① ハンチントン病、ALS、脊髄小脳変性症における新規創薬ターゲット分子、医薬品候補分子

- ・ in vivo データ（遺伝子欠損マウスを用いた解析でも可）のあるものが望ましい。SNP 等のヒトのエビデンスがあるものも評価の対象とする
- ・ ALS および脊髄小脳変性症については、孤発性 ALS や多系統萎縮症（MSA）のものが望ましい

### ② 上記疾患領域における医薬品候補分子のヒト外挿性を向上させる評価技術

## <自己免疫疾患>

### 2.1 自己免疫疾患治療における新規創薬標的分子、又は医薬品候補物質、あるいはコンセプト・アイデア

- ・ 難病もしくは難治性の自己免疫疾患（全身性エリテマトーデス、強皮症、シェーグレン症候群）、関節リウマチに適応可能であること
- ・ 既存療法に対して優位性が期待できるコンセプト・アイデアを有すること
- ・ 臨床以前の段階にあること
- ・ 医薬品候補物質（低分子化合物・ペプチド・抗体・タンパク質等）があることが望ましい

## <救急領域>

### 3.1 敗血症における新規創薬標的分子、又は医薬品候補物質

- ・ 免疫系を活性化する作用機序を有すること
- ・ in vivo データがあることが好ましい

### 3.2 急性肺障害（ALI）や急性呼吸窮迫症候群（ARDS）における新規創薬標的分子、又は医薬品候補物質

### 3.3 重症感染症（菌血症、感染性心内膜炎、重症肺炎）における新規創薬標的分子、又は医薬品候補物質

- ・ 一般的な抗菌剤は対象外とする

### 3.4 急性腎障害（AKI）における新規創薬標的分子、又は医薬品候補物質

## **<骨・軟骨領域>**

### **4.1 骨系統の難病・希少疾患における医薬品候補物質**

- ・ 対象疾患：後縦靭帯骨化症(OPLL)や進行性骨化性線維異形成症(FOP)、骨壊死、骨形成不全症など
- ・ 創薬モダリティは問わない(低分子化合物、ペプチド、抗体、タンパク質、遺伝子治療など)

### **4.2 骨系統の難病・希少疾患をターゲットとした創薬において、新規かつヒト臨床を反映した創薬技術**

#### **① 評価系(細胞/動物モデル)**

後縦靭帯骨化症(OPLL)や進行性骨化性線維異形成症(FOP)、骨壊死、骨形成不全症など骨系統の難病・希少疾患に対する創薬ターゲットを探索するための細胞/動物モデル。

#### **② バイオマーカー、画像診断法などの創薬技術**

上記疾患の進行あるいは治療効果を非(低)侵襲かつ経時的モニタリングできる下記のいずれか

- a) 血中又は尿中バイオマーカー
- b) 力学評価装置
- c) CT, MRI などの画像撮影及び解析技術(非臨床でも臨床でも使える技術が望ましい)

### **4.3 軟骨無形成症など軟骨の難病・希少疾患における医薬品候補物質**

- ・ 対象疾患：軟骨無形成症(軟骨低形成症、軟骨胃栄養症を含む)
- ・ 創薬モダリティは問わない(低分子化合物、ペプチド、抗体、タンパク質、遺伝子治療など)

### **4.4 関節軟骨の変性・損傷においてマイクロフラクチャー(MF)や細胞治療などの既存外科治療の効果を高める技術**

- ・ 医薬品候補分子(創薬モダリティは問わない)又は、医療材料(膜、糊、基材など)。
- ・ 関節内への局所使用(関節鏡下手術含む)で患部に留まり、骨髄や細胞の生着を促し、正常軟骨への再生を促進する機能を有すること

## ＜筋疾患領域＞

### 5.1 疾患領域における新規創薬標的分子、又は医薬品候補物質

- ・ 対象疾患：サルコペニア、癌性悪液質、廃用性筋萎縮、筋ジストロフィー、重症筋無力症、ALS、その他難治性筋疾患
- ・ 既新規性、有用性が高く、画期的新薬（ファースト・イン・クラス）となりうる標的分子が望ましい
- ・ 老化・寿命制御、老化細胞除去、NAD/Sirtuin シグナルに関連して筋量・筋力増加および運動機能向上を達成可能な標的分子が望ましい
- ・ 標的臓器は筋肉に限らない。副次的であっても筋肉に作用し筋疾患治療薬になり得る標的分子は評価の対象とする。ただし、癌性悪液質に対する抗がん剤治療は除く
- ・ *in vivo* データ（遺伝子欠損マウスを用いた解析でも可）のあるものが望ましい。SNP 等ヒトのエビデンスがあるものも評価の対象とする

## ＜創薬基盤技術＞

### 6.1 溶液 NMR 法で、膜タンパク質や分子量 4 万以上の可溶性タンパク質を解析するための安定同位体標識法

次の A. または B のどちらかを満たすもの

- A: 発現量を低下させずに、重水素化タンパク質が得られる標識法
- B: 重水素化以外で、重水素化と同等かそれ以上の感度と分解能が得られる標識法
- ・ 発現細胞種は問わない（大腸菌・酵母・昆虫細胞・哺乳細胞など）
  - ・ 選択的標識や非天然アミノ酸の利用は可とするが、発現後に修飾する標識法は不可
  - ・ 既存の測定法では対応できない標識法の場合、対応する新たな測定法がセットであること

### 6.2 ペプチド分子の細胞膜透過性を向上させ、細胞内を標的としたペプチド創薬を可能とする技術

- ・ 培養細胞内でのペプチド分子の生理活性が確認されていること（細胞死による活性確認は除く）
- ・ ペプチドの大きさは 40 アミノ酸以下とする

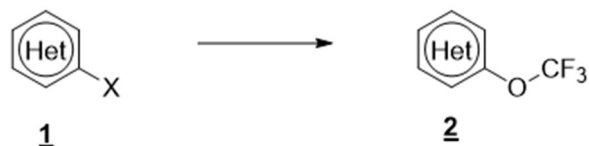
### 6.3 標的タンパク質とペプチド分子との共結晶構造情報を利用して、低分子医薬品候補化合物を取得する技術

例：共結晶構造情報を利用した低分子化合物デザイン方法又はインシリコスクリーニング方法

#### 6.4 芳香族ヘテロ環化合物(化合物 1)に直接 OCF<sub>3</sub> 基を導入する合成法

以下の特徴を有する反応

- ・ ハロゲン、もしくはその他修飾された官能基からの変換であること
- ・ ピリジンや医薬品中間体で反応が進行すること

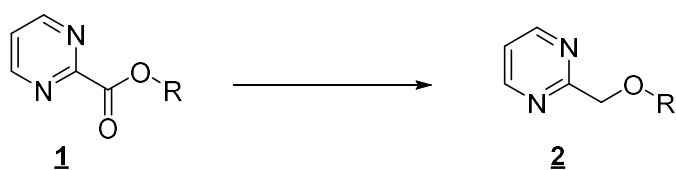


X=Cl, Br, I, etc.

#### 6.5 ピリジン 2 位誘導体のエステル還元反応による新規エーテル合成法

以下の特徴を有するスケールアップに適した反応

- ・ 温和な反応条件
- ・ 簡便な反応操作および後処理
- ・ 高額な試薬の回避



R = alkyl

## ＜薬物動態＞

### 7.1 薬物相互作用を精度高く予測できる内因性バイオマーカー測定技術

例： a) 新規内因性バイオマーカー， b) 既存の内因性バイオマーカーの測定感度を上げる技術

- ・ 血漿または尿検体から検出可能な分子であることが望ましい
- ・ LC-MS/MS で測定できない分子や、げっ歯類のみで観察される分子は対象外とする

### 7.2 開発候補化合物の中樞移行性を in vivo で高精度に評価できる技術

例： 脳内毛細血管非透過マーカーを用いた脳実質中薬物濃度の補正技術

- ・ 経口投与により評価できる技術であることが望ましい
- ・ 放射性物質を用いる技術や Imaging MS は対象外とする

### 7.3 ペプチドの消失メカニズムを、低コストで定量的に解析できる方法

例： a) 非天然アミノ酸を低コスト／短時間で <sup>14</sup>C ラベル化する技術， b) 非天然アミノ酸を含むペプチドの代謝分解位置を予測する in silico 技術

- ・ 既存技術改良、新規技術、新規ソフトウェア開発を含む
- ・ イメージング M&S は対象外とする
- ・ 既存技術よりコストや時間を削減可能な技術が望ましい



## ＜製剤技術＞

### 8.1 水溶液中のペプチド製剤およびタンパク質製剤の安定化技術

#### 除外事項

- ・ 凍結保存を用いるアプローチ
- ・ 皮下注射の際に問題となるアプローチ
- ・ 薬剤と共有結合させるアプローチ

### 8.2 ペプチドおよびタンパク質の徐放技術

- ・ in vivo のデータがあることが望ましい
- ・ 下記3つの項目をクリアしている案件
  - a) 4週間以上の放出制御を確認済み
  - b) 既存徐放技術に対する優位性が明確
  - c) 皮下投与可能

### 8.3 ペプチドの経口吸収性を向上させる技術又はその他の投与の形態で血中濃度持続性を向上する技術

例: a) ペプチドの経口投与時にバイオアベイラビリティが10%以上となる技術, b) その他の投与の形態においてはペプチドの血中濃度を数日間持続可能な技術

- ・ プロドラッグ化を含む本体への修飾や改変、製剤技術、低侵襲性デバイスを含む
- ・ preliminary in vivo データ取得済みの技術が望ましい