

## EGFRチロシンキナーゼ阻害剤

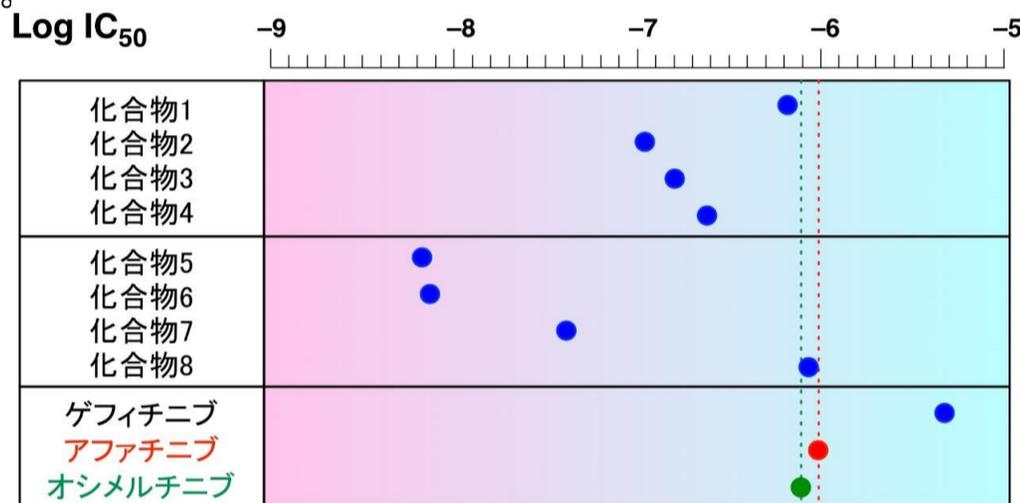
主たる提供特許	出願者	国立大学法人長崎大学、岩手医科大学、公益財団法人がん研究会
	題名	第四世代EGFRチロシンキナーゼ阻害剤
	番号	特願2017-064866

## 耐性変異EGFRに有効な可逆的チロシンキナーゼ阻害剤

## 技術概要

## 発明の背景

・肺がんの80%は非小細胞肺がんであり、その非小細胞肺がんの20~30%に上皮成長因子受容体(EGFR)の遺伝子変異が認められています。このような非小細胞肺がんに対して効果を示すチロシンキナーゼ阻害剤は、種々承認されていますが、薬剤の継続使用により二次的、三次的な耐性変異が生じています。本技術の化合物は、これら耐性変異に有効な新しい治療薬になり得ると考えられます。



BaF3細胞を用いたEGFR阻害活性評価

## 効果

- ・本化合物は、現在治療法のないC797S変異型三次耐性EGFRに有効です。
- ・細胞試験では、第三世代EGFR-TKIであるオシメルチニブと比較して100倍以上の阻害活性が示されました。
- ・構造活性相関に基づく合成展開が可能です。

## 応用分野

## 実用化例

抗がん剤などの医薬品

## 実用化に向けた課題

動物試験及び安全性試験、将来的には臨床試験が必要です。

## 企業へのメッセージ

- ・活性の高い新規化合物を複数見出しておりますので評価用の化合物の提供が可能です。
- ・共同研究先企業を探しています。