

1,3-ジオキサラン誘導体 D-532

経口投与にて、糖尿病性腎症の諸症状のほか
腎組織障害をも改善します！

概要

血液透析を要する患者数は増加の一途をたどっており、国内患者数の約40%は糖尿病の合併症である糖尿病性腎症（DN）を原因とする。DN治療の中心は血糖や血圧のコントロールによる対症的なもので、今日まで根治を可能とする有効な治療薬は開発されていない。

本発明は、糖・脂質代謝関連遺伝子のグルコース応答性転写因子ChREBP(Carbohydrate responsive element binding protein)の機能抑制をコンセプトとするDNの治療剤に関するものである。

東北大学で独自開発したChREBPレポーターアッセイによるハイスループットスクリーニングにより、D-532を同定した（図1）。D-532の類縁体、異性体の評価も行ったが、D-532の薬効が現時点で最も高いことを確認している（Data not shown）。

D-532は、DNモデルにおいてChREBP標的遺伝子群の発現を抑制するほか（図2）、尿中アルブミン排泄量や血中クレアチニンといったDN臨床所見を改善した（図3）。さらに、糸球体の足突起消失を改善させたことから（Data not shown）、D-532は腎組織に直接作用して効果を発揮する化合物である可能性が示唆される。

現在、D-532の溶解性を改善した状態でのvivo/vitro試験の再実施と用量検討、ターゲット分子の探索を続けている。

応用例

- 糖尿病性腎症治療薬
- その他腎組織障害の治療薬

知的財産データ

知財関連番号 : WO2020/166710
 発明者 : 菅原 明、横山 敦、鈴木 歩、岩淵 好治、土井 隆行
 整理番号 : T18-094

図1. D-532とレポーターアッセイでの濃度依存的活性

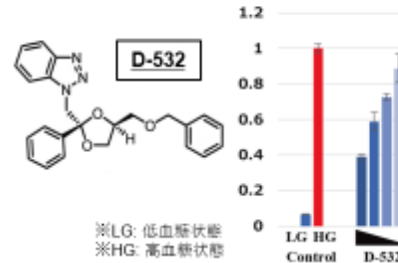


図2. DNモデルへのD-532投与による腎臓でのChREBP標的遺伝子発現変動

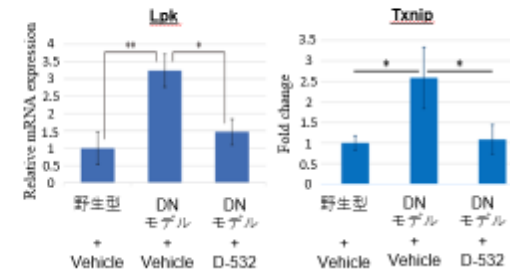
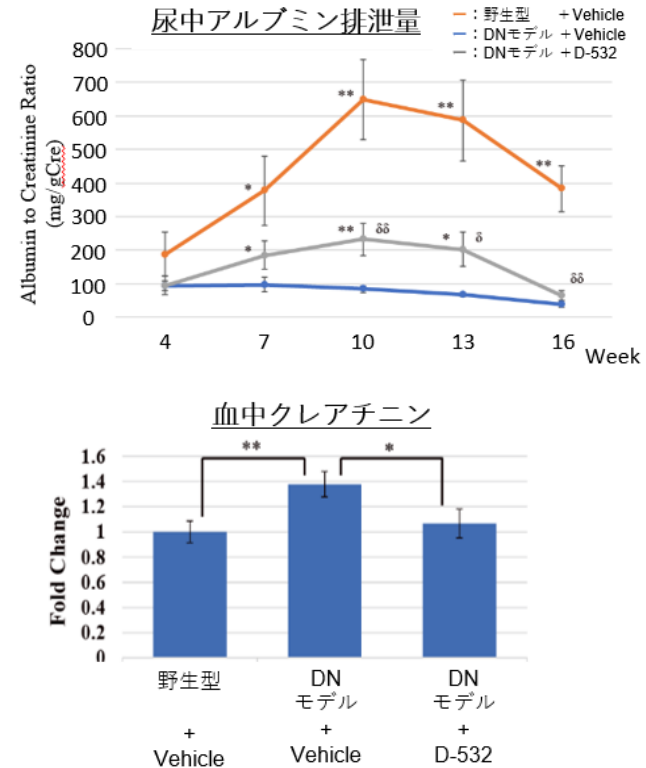


図3. 尿中アルブミン排泄量、血中クレアチニンの改善効果



お問い合わせ

本資料をダウンロード



お問い合わせ

<https://www.t-technoarch.co.jp/contact.html>



発明案件を随時更新中

<https://www.t-technoarch.co.jp/anken.php>



LinkedIn ページをフォロー

<https://www.linkedin.com/company/tohoku-techno-arch>



Leading you to Successful Industrialization



株式会社

東北テクノアーチ

TOHOKU TECHNO ARCH