

発表内容

エーザイ株式会社のケミカルバイオロジー的
抗がん剤創薬の起・承・転

起. スルフォン・アミド構造を中心にした展開

承. Pladienolideの発見からの展開

転. HALAVEN[®]資産の最大化を目指した展開

「結」については、これからの展開によって変わってくるべきもので、現時点において明確に記述できるものではないと考える。

エーザイ（株）抗がん剤グループの歩み

1987- 1999

(マイナー時代:起)

- 探索第二研究部二室
- 探索第五研究部
- バイオロジーユニット4

- **チューブリン作用薬(E7010)の創製**
- **Indisulam (E7070)の創製**
- 血管新生阻害薬(E7820)の創製

2000- 2008

(フォーカス領域時代:承)

- 創薬第二研究所

- VEGFRs阻害剤Lenvatinib (E7080)の創製
- c-Met阻害剤Golvatinib (E7050)の創製
- **Pladienolide由来E7107の創製**
- チューブリン作用薬HALAVEN®の創製
- MEK阻害剤E6201の創製

2009- 2012

(フランチャイズ領域時代:転)

- オンコロジー創薬ユニット
- グローバルケミストリー部 **ケミカルバイオロジー室** 設置

- **チューブリン作用薬HALAVEN®の製造承認**

エーザイ株式会社における経験（抗がん剤開発におけるケミカルバイオロジー的側面）まとめ

1. スルホン・アミド構造をもった化合物群から、E7010(チューブリン作用薬)、Indisulam, 更にはE7820(血管新生阻害剤)を創製した。この経験は、**Focused Chemical Library**(スルホン・アミド化合物群)と**Screening & Profiling** (Cell Cycle Analysis)という、ケミカルバイオロジーの要素を含んでおり、更にIndisulamの**MOA & Target ID**の試みは、弊社の技術基盤確立へ繋がった。
2. 新規天然物Pladienolide由来のE7107の**MOA & Target ID**の成功は、ケミカルバイオロジー的アプローチの真の重要性を社の内外に知らしめる上で、極めて重要なイベントであった。
3. エーザイ自社開発品のHalavenの価値の最大化を目指す上で、ケミカルバイオロジー的アプローチは必須の要素である。そのため、弊社オンコロジー創薬ユニットのケミカルバイオロジー室が構築している**Screening & Profiling** 及び**MOA & Target ID**技術を駆使して、更なる成功体験を目指した努力を続けている。