

## 抗エイズウイルス (HIV) 活性を有するベンゾイソチゾロピリミジン誘導体

ライセンス契約を受けていただき 本発明の実用化を目指していただける企業様を求めます。

エイズウイルス(HIV)に強い抗ウイルス効果があり、構造として新規な化合物群を提供します。

## ◆背景

これまでエイズウイルス(HIV)治療薬として、核酸系逆転写酵素阻害剤・プロテアーゼ阻害剤・インテグラーゼ阻害剤タイプなどがあり、これら阻害剤タイプを組み合わせた療法で一定の効果が得られています。しかしHIVはウイルス遺伝子の突然変異が起きやすく、容易に既存薬剤への耐性を獲得しやすい性質をもっています。その為、遺伝子変異に関係しない作用機序での新薬開発が望まれています。

## ◆発明概要と利点

上記課題を鑑み、京都大学ではピリミドベンゾチアジン-6-イミン骨格化合物から新規化合物 (ベンゾイソチアゾロピリミジン誘導体) を合成し、これらの誘導体が抗HIV活性を有することを見いだしました。

➢ 新規化合物群 (ベンゾイソチアゾロピリミジン誘導体) であること

新規化合物群であり、またそれらの有機合成が確立されております。

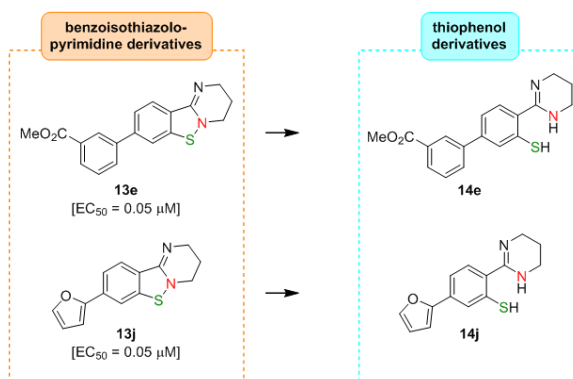
➢ エイズウイルス(HIV)を含むエンベロープウイルスに抗ウイルス活性があること

上記新規化合物群の中で、最も高い抗エイズウイルス活性を有する物質は  $EC_{50}$  値 = 50nM (図1) と非常に高い活性を有しております。また、これらの化合物群はエイズウイルス以外にもRNA、DNAエンベロープウイルスにも活性を示しております。

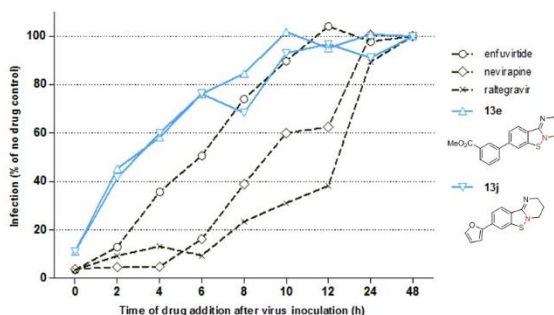
➢ 化合物の作用点が細胞膜結合または融合であることが示唆されていること

上記新規化合物群は、図2に示すようにウイルス添加後に化合物を時間別に添加したときに、早い時間から抗ウイルス活性を示しております。薬剤耐性エイズウイルスに対しても活性があることを確認しております。これらの事から、本化合物群はウイルス感染の初期段階で作用していることが示唆されます。

【図1】 新規化合物であるベンゾイソチアゾロピリミジン誘導体



【図2】 化合物添加時間を変えた実験結果



## ◆開発段階

- 細胞レベルでの抗ウイルス活性評価済み
- 有機合成が確立済み

## ◆発表状況 論文2報

- Org Biomol Chem. 2015 Apr 28;13(16)
- Bioorg Med Chem. 2015 Apr 1;23(7)

## ◆適応分野

- 医薬品分野
- 化学素材分野

## ◆希望の連携形態

- 実施許諾 (非独占/独占)
- オプション (非独占/独占)

※特願2014-206613

## ◆お問い合わせ先

京都大学産学連携担当

関西TLO株式会社

ライセンスング・アソシエイト

担当：清水 基宏

〒606-8501

京都市左京区吉田本町

京都大学 産官学連携本部内

(075)753-9150

shimizu@kansai-tlo.co.jp



関西TLO株式会社  
TECHNOLOGY LICENSING ORGANIZATION