



發明名稱:新穎性 HDAC6 抑制劑之抗癌藥物研發

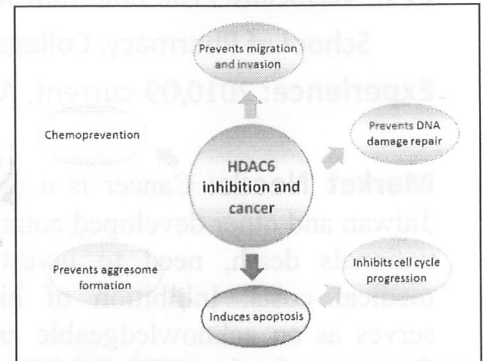
(以下內容一頁為限，不可揭露關鍵技術內容；填表完成後請刪除此行)

發明人：楊家榮 副教授

單位：國立臺灣大學 藥學系/研究所

簡歷：2010/09 迄今 國立臺灣大學藥學系副教授

市場及需求：癌症是目前仍無法有效治癒的疾病。在台灣及多數已開發國家癌症均是造成國民死亡的頭號疾病，需投入龐大的社會資源及醫療成本。抑制組蛋白去乙酰酶 (Histone deacetylases; HDACs) 是已被接受的癌症治療標的。目前已有四個非選擇性的組蛋白去乙酰酶抑制劑在美國上市，但在台灣尚未引進這些藥物。



技術摘要(含成果): MPT0G211 對 HDAC6 的選擇性與其他 HDAC 亞型相較高達數千倍至數萬倍，也遠比目前唯一正在進行臨床試驗的 HDAC6 抑制劑 ACY-1215 高(選擇性只有數十倍到數千倍)。體內與體外實驗證實 MPT0G211 在多種血液性癌症顯示很好的抑制癌症細胞生長的效果，對固態腫瘤的抑制效果也不錯。研究結果顯示 MPT0G211 與 ACY-1215 相較有更強的抑制 HDAC6 活性與更好的選擇性，極具開發價值。

優勢：目前四個非選擇性的組蛋白去乙酰酶抑制劑 Vorinostat (SAHA, Zolinza®)、Romidepsin (FK228, Istodax®)、Belinostat (PXD-101, Beleodaq®) 及 Panobinostat (LBH-589, Farydak®) 被美國 FDA 核准使用於 cutaneous T-cell lymphoma (CTCL)，peripheral T-cell lymphoma 與 multiple myeloma，然而這幾個藥物已有心血管方面副作用之報導。HDAC6 因其標的為 non-histone protein，且 HDAC6 的基因剔除鼠並未產生嚴重發育遲緩與重要器官損傷；故推測 HDAC6 抑制劑不會產生嚴重的副作用。我們的結果也顯示 MPT0G211 並不抑制 hERG 基因，顯示其產生心血管副作用的機會不大。

競爭產品：ACY-1215 (Acetylon Pharmaceutical, Inc.) 是目前唯一進入臨床試驗二期的 HDAC6 抑制劑，其適應症為與蛋白酶體抑制劑 (bortezomib, carfizomib 等) 或副腎皮質激素 dexamethasone 合併治療多發性骨髓瘤。

專利現況：

- (1) 2015 年已向 NRPB 辦公室提出申請美國暫時專利，還在審核中。
- (2) 本發明之相關結果除向衛福部繳交成果報告外，均未公開發表。
- (3) 本團隊成員先前之研發成果 MPT0E028 正在進行臨床一期試驗，已累積相當經驗。

聯絡方式(請不用填):

臺大產學合作總中心

Tel: 02-3366-9945, E-mail: ntuciac@ntu.edu.tw

本資料僅供國立臺灣大學專利/技術申請使用，嚴禁使用全部或部分內容於其他用途。若有疑問請與我們聯繫，我們將盡力協助您。