



# 一種新一代抗拓撲異構酶的癌症藥物

提案人：李財坤 教授

單 位：國立臺灣大學醫學院微生物學科暨研究所

簡 歷：Professor of Microbiology and Associate Dean、Director, Office for International Affairs, College of Medicine、Chief Executive Officer, Center for Genomic Medicine、National Taiwan University, Taiwan;  
tsaikunli@ntu.edu.tw

## 市場及需求：

小分子抗癌藥物、藥物副作用緩和劑

## 技術摘要(含成果)：

本項技術主要是創新發展新一代抗拓撲異構酶 II 同功酵素的世界獨一研發平台與其應用於開發之具高療效與低副作用的嶄新腫瘤藥物。藥物治療對於疾病的專一選擇性 (selectivity) 作用在藥理學上是很重要的研究課題，增加療效並避免副作用。我們的研究顯示，DNA 拓撲異構酶的抗癌藥物在選擇性腫瘤毒殺作用是一個潛力來源。值得注意的是，人類細胞有兩種第二型拓撲酶的同功酵素，而最近研究亦發現藥物導致的 hTop2 $\alpha$  之標的作用與 hTop2 $\beta$  的基因和心臟毒性分別是造成抗癌療效與副作用的主因，因此 hTop2 $\alpha$  專一標的抗癌藥物與 hTop2 $\beta$  專一的拮抗劑會有臨床優勢。以此嶄新機轉開發對抗癌的新藥及減低副作用的拮抗劑，會為病患帶來莫大治療的契機，在全球腫瘤藥物的市場也相當具有競爭力。本研究團隊完整，結合分子藥理、細胞生化及藥物化學等學研專長，已建立世界獨步的先導藥物之同功酵素的專一性細胞、分生與結構篩選平台，發展出先導藥物 (包含 Top2 $\alpha$  專一的抗癌藥與 Top2 $\beta$  專一的拮抗劑)，動物實驗證明比目前抗癌藥物療效更好且具較低的毒性與臨床副作用，顯示創新優勢。本團隊並以專利保護、結構為基礎的獨特藥物設計指南 (structure-based rational design) 來設計化合物，經合成取得，以適當的癌症細胞與動物模型進行實驗，並獲得良好的初步成果。

## 優勢：

技術移轉可行，以此嶄新機轉開發對抗癌的新藥及減低副作用的拮抗劑，會為病患帶來莫大治療的契機，在全球腫瘤藥物的市場也相當具有競爭力。

## 競爭產品：

Etoposide、Doxorubicin、Mitoxantrone

## 專利現況：

- (1) 本技術已有相關專利 (美國專利證號: US\_8765443\_B2)。
- (2) 本研究團隊具有數十年研究經驗。

## 聯絡方式(請不用填)：

臺大產學合作總中心

Tel: 02-3366-9945, E-mail: [ntuci@ntu.edu.tw](mailto:ntuci@ntu.edu.tw)