

## 附件四、技術說明表



### 喹啉衍生物及其用途

**提案人：** 楊家榮 教授

**單位：** 國立臺灣大學 藥學系/研究所

**簡歷：** 2018/08 迄今 國立臺灣大學藥學系教授

**市場及需求：** 人體主要器官如肺、腎臟、心臟等都會因受傷、感染、環境因素或目前尚未了解的原因產生不可復原的纖維化疾病，嚴重威脅患者生命。以特發性肺纖維化為例，患病率和發病率仍不清楚，報告之間存在很大差異。然而診斷後平均存活時間只有 2-5 年，急性惡化後存活時間縮短為 2-3 個月。根據 Allied Market Research 公司的估算，全球特發性肺纖維化的市場由 2021 年到 2030 年的年複合增長率為 7%，到 2030 年約可達 61.7 億美元。另一常見的腎臟纖維化常見於多種慢性腎臟疾病的後期，根據 Data Bridge Market Research 公司估算，全球終末期腎臟疾病的市場由 2023 年到 2030 年的年複合增長率為 13.4%，到 2030 年約可達 2700 億美元。因此纖維化疾病在發生成因尚未明朗且現有藥物控制不佳的情況下，急需要有新藥物的開發。

**技術摘要(含成果)：** 先導藥物具有 CDK8 高度選擇性，對 CDK 家族其他成員或其他種類激酶沒有抑制作用，且對 CDK8 活性具有強效抑制效果( $IC_{50}$  16 nM)。體內與體外實驗證實先導藥物對特發性肺纖維化、腎臟纖維化、癌症轉移等疾病具有很好的抑制效果，均優於相關疾病目前的臨床用藥，極具開發價值。

**優勢：** 研究顯示 CDK8 基因剔除在成年動物具有良好耐受性，並不影響免疫、血液等功能。故推測 CDK8 抑制劑不會產生嚴重的副作用。先導藥物具有 CDK8 高度選擇性及強效 CDK8 抑制作用，預計產生副作用的風險較低。

**競爭產品：** 目前尚未有 CDK8 抑制劑上市。RVU120 (Ryvü Therapeutics) 及 BCD-115 (Biocad) 是目前唯二進入臨床試驗二期、一期的 CDK8 抑制劑，其適應症為急性骨髓性白血病與 ER(+) Her2(-) 乳癌後期轉移，並未進行在纖維化疾病等的應用研究，且研究顯示此二競品具有代謝不穩定、對 CDK8 選擇性欠佳等缺點，而藥物的選擇性欠佳意味著可能產生副作用或脫靶效應的風險偏高。

#### 專利現況：

- (1) 本技術將申請中華民國專利及美國專利。
- (2) 本研究團隊具有十餘年藥物研究經驗並獲有多項國內外專利，如近幾年獲得中華民國 I659949、I761471、I398277、I396533 等專利，及獲得美、日、韓、歐盟、英、法、德、瑞士、澳、印等國際專利。

#### 聯絡方式(請不用填)：

臺大產學合作總中心

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