

## 研究目的

世界中で、医療用麻薬であるオピオイドの過剰摂取による中毒死が急増し、『オピオイドクライシス』として深刻な社会問題となっています。この喫緊の課題に対し、中毒治療薬である $\mu$ オピオイド受容体(MOR)拮抗薬のニーズが急速に高まっています。しかし、FDA承認薬であるナロキソン(NLX)やナルメフェンには、作用時間の短さ、副作用、激しい退薬症候など様々な課題があり、より良い治療薬の開発は急務です。これらの課題を克服するため、構造的に簡潔なフェンタニル誘導体を基盤とした新規 $\mu$ オピオイド受容体拮抗薬を開発し、安全かつ有効なオピオイド中毒治療薬の実現を目指します。

## 研究概要

我々の化合物SDFV-seriesはフェンタニル構造に基づく世界で初めてのMOR拮抗薬です。投与4時間後も脳中に残存するSDFV-114、より血中・脳中濃度推移の減少が緩徐なSDFV-124を創出しました。これら化合物は、脳内に長くとどまり作用時間が長いため、一回の投与で十分な治療効果を発揮します。また、動物実験の結果から、退薬症候が穏やかであることがわかりました。フェンタニルの構造を基にした合成は容易に行うことができ、安価に大量供給も可能です。この化合物はオピオイド急性中毒の新しい治療薬として大いに期待されます。



構造を改良

MOR拮抗薬

新規物質  
SDFV-series

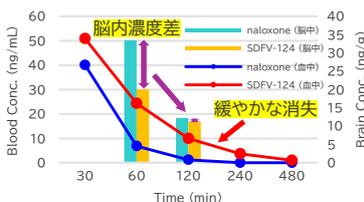
### 従来・競合との比較

- ・ナロキソンより長時間の効果持続
- ・ナルメフェンより軽い副作用
- ・既存薬より緩徐な退薬症候
- ・化学合成が既存薬より容易かつ安価

### 想定される用途

- ・オピオイド急性中毒の解毒薬
- ・オピオイド系鎮痛薬の過量投与の治療

MOR拮抗薬	ナロキソン	ナルメフェン	SDFV-series
効果 (拮抗作用)	-	NLXの4倍	NLXの1-10倍
効果時間	×	○	○
副作用	○	×	○
退薬症候	×	×	○
構造展開の容易さ	×	×	○



### 実用化に向けた課題

- ・体内動態の評価
- ・安全性評価: 安全性評価のための試験方法やプロトコルの提供、実施

### 企業へ期待すること

- ・資金調達(国プロへの共同申請等)
- ・社会ニーズの把握、市場調査
- ・課題検証
- ・皆様の豊富なご経験・幅広いネットワークでのご支援ください

## POINT

- ・長い作用時間
- ・緩徐な退薬症候
- ・作動活性の非発現による副作用の低減
- ・安価で大量供給可能

## 今後の展開

2027. 4. 非臨床試験、起業  
2030. 4. 第一相臨床試験  
2032. 4. M&A

- 関連制度 : AMED「橋渡し研究プログラム」シーズンA(慶應拠点)
- 受賞歴 : 2024年度日本薬学会 医薬化学部会メディシナルケミストリーシンポジウム(MCS) 新人賞
- 知的財産権: 特願2024-174109