

新規血管拡張剤の**家畜繁殖**および **ヒトの生活改善**への応用

金沢大学 名誉教授
染井正徳

研究背景 1

本発明の目的と社会的要請

1. **世界の**人口の増加に伴い、人類が遭遇する深刻な**食料難**（食肉供給枯渇等）を解決しなければならない。
2. **世界中に 1 億人以上存在する勃起不全 (ED; Erectile Dysfunction)**, **禿げ**, **毛が薄い**等, 生活の質 (QOL) が低下して, 密かに悩んでいる人達を, 救いたい。
3. **遊牧民の生活を保障しつつ、ヤギの頭数を減らし、砂漠化を止め、砂漠緑化により、地球温暖化を止めたい。**

前述 1～3の難問を**解決する手段**

ヤギ(**家畜**)のカシミア生産(**育毛**)と多産(**肉の提供**)を
同時に可能にする,**育毛繁殖剤**の開発

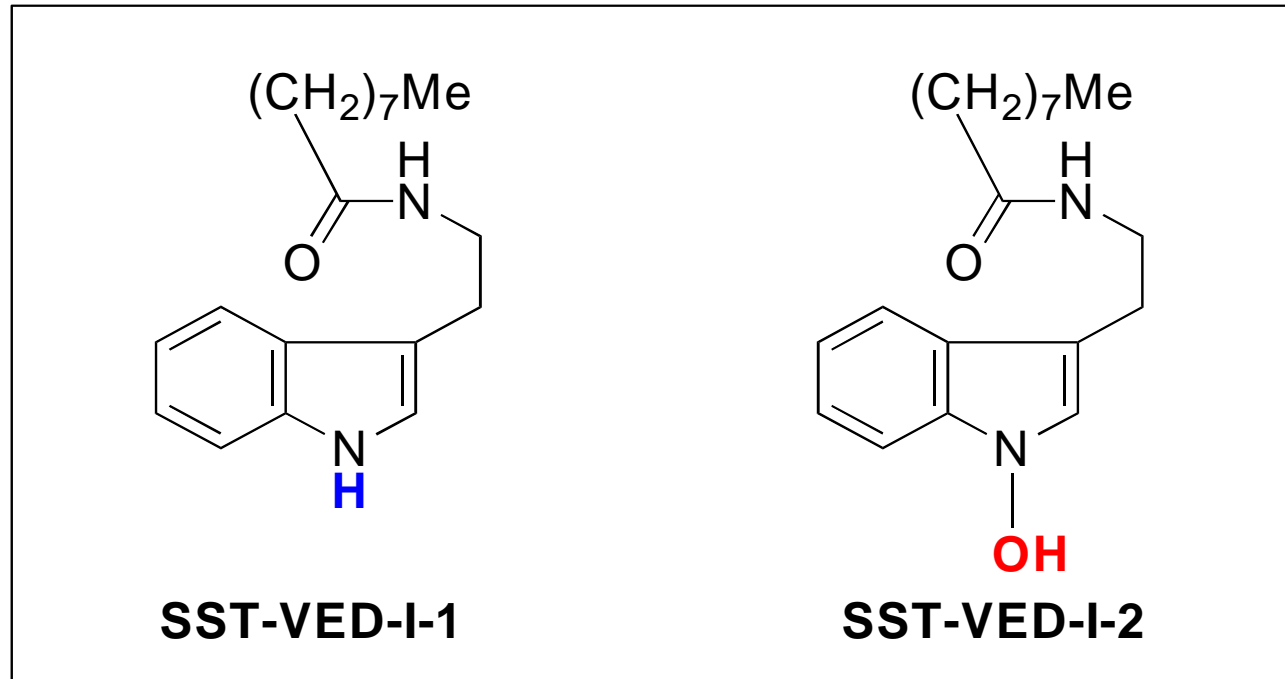


新規SST-VED (Vasodilator, Erectile Dysfunction)
化合物群の開発

命名

Somei, Shigenobu, Tanaka
Vasodilator, Erectile Dysfunction

SST
VED - - - BED



勃起不能 (ED) 治療薬、 繁殖促進薬、 育毛、 増毛薬
となる可能性を見出した。

応用例、適用事例(育毛、増毛)の紹介

諸剤形に加工可能

散剤：カシミアヤギが、自分から舐めに来るように、ガラクトースを増量剤として SST-VED-I-1 を 0.1 重量% となるよう混和製造し、1 日 1 回服用することにした。

服用量： SST-VED-I-1, 1.0 mg / 1 個体, 1 日。

中国内モンゴル
阿拉善盟
固定砂丘遊牧民
バイアルさんから

ヤギ購入
2006年5月



ヤギカシミア発毛実験(第2実験場,1歳)

2006.9.23 手前:2ヶ月服用、奥:未服用



カシミア (毛) の生産量

実験場 1 2006.5 (2歳、雄)~2007.5

内モンゴアラシャン盟、ヤギ農家、巴依尔 (バイアル氏) 協力

ヤギ個体	カシミア (毛) の重量 (g)	
	服用ヤギ	未服用ヤギ (対照)
No. 1	375 (167%)	225 (100%)

2007.6 (3歳、雄) ~2008.6

No. 1	350 (175%)	200 (100%)
-------	------------	------------

カシミア(毛)の生産量

実験場 2 2006.7(0.5歳, 雄) ~2007.5 内蒙古アラシャン盟、ヤギ農家、柴紹錦(チャイショウジン)氏協力

ヤギ個体	カシミア(毛)の重量 (g)	
	服用ヤギ	未服用ヤギ(対照)
No. 1	320	300
No. 2	300	200
No. 3	205	170
平均	275 (123%)	223.3 (100%)

年来のハゲ治療

VED 1号適用, 62才女子: June 7, 2009—Oct. 16, 2009

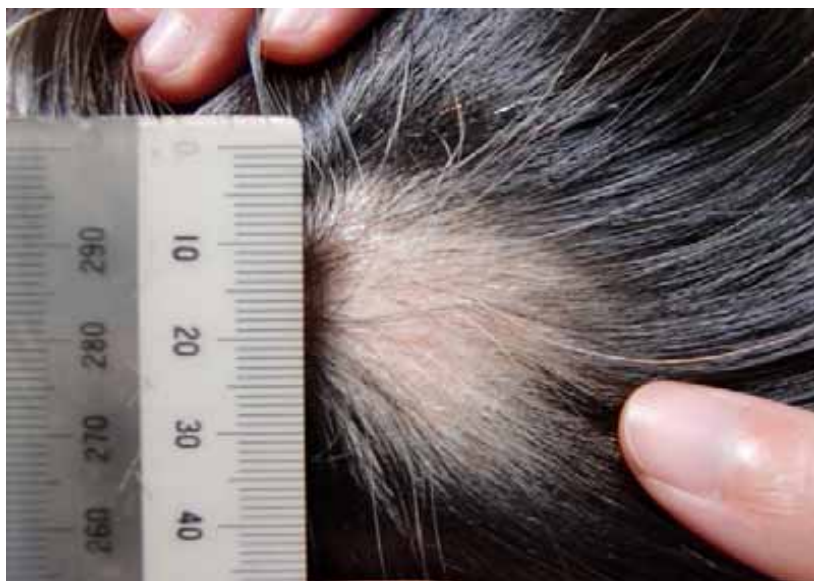
June 7



Aug. 23



Sept. 20



Oct. 16



2年目:2007年5月~2008年3月

服用雄山羊2頭のみ、子ヤギ 90頭誕生!!



1年目、2年目とも
全ての子山羊が生存!!
(生存率が100%)
(通常80~90%)

4年目, 80頭誕生の中から, 5年目に向けての種ヤギ決定。
サンプル, 5年目分手渡し (450日分, 2010年6月21日)

繁殖実験, 継続実施。

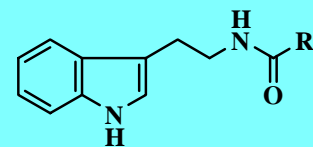
選抜された子山羊



選抜された子山羊



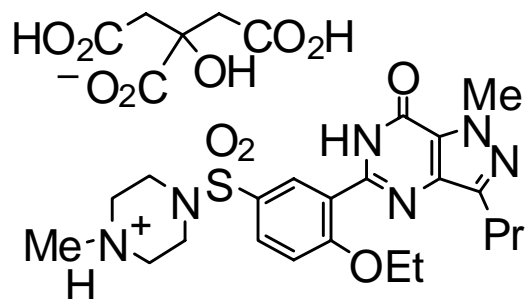
ED治療に関する従来の技術と問題点



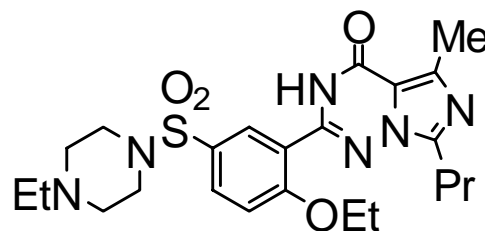
SST-VED-1-1

PDE-5 酵素阻害薬

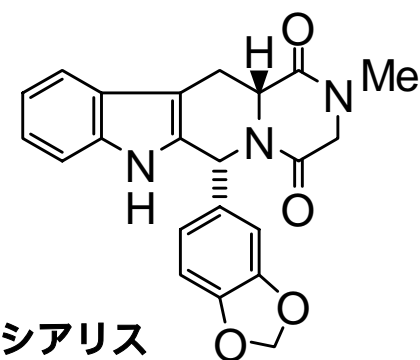
構造比較



バイアグラ



レビトラ



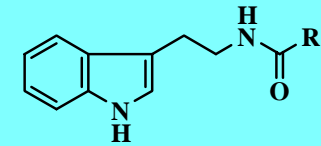
シアリス

1. 複雑な化学構造を持つ高分子量の化学合成品である。
2. 合成は多段階を必要とし、非効率、非経済的である。
3. PDE-5 酵素阻害により生理作用を発現する。
多種の副作用がある。
4. ヤギや家畜への応用データは無い。

ED治療に関する従来の技術と問題点

α 2阻害薬

1. 天然物である。
2. 高分子量かつ複雑な化学構造。
3. 漢方薬として、 α 2阻害薬が、EDに有効であるという長年の人体実験を経た実績がある。
4. 劇薬であり、使用量および、その副作用には、細心の注意が必要である。

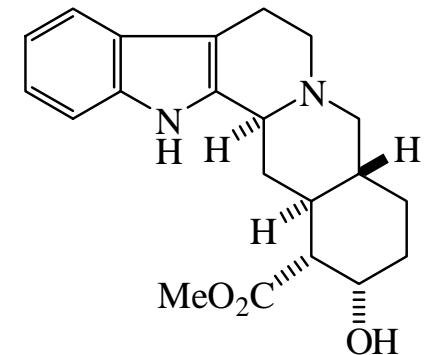


SST-VED-1-1

構造比較



漢方薬ヨヒンビン



新技術の特徴・従来技術との比較

SST-VED-I-1 化合物の安全性

毒性試験

雄のddyマウス：1ヶ月

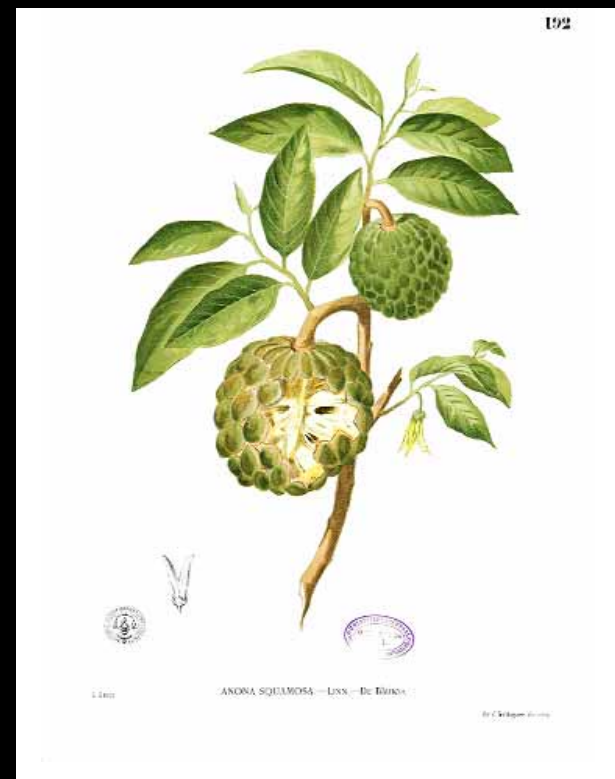
LD₅₀ > 80 mg/kg：解剖所見で異常認めず。

NH体は天然物：バンレイシ科植物の
種子含有成分。

NHインドール体は、バンレイシ属植物の種子成分として単離構造決定された天然物である
N-アシルトリプタミンの一種である。^{1,2)}

これらの果実は生食の他、ジャムやママレード、アイスクリームなどに加工されて食されている。

- 1) D. Chavez, L.A. Acevedo, R. Mata, *J. Nat. Prod.*, **62**, 1119-1122 (1999)
- 2) U. Maeda, N. Hara, Y. Fujimoto, A. Srivastava, Y.K. Gupta, M. Sahai, *Phytochemistry*, **34**, 1633-1635 (1993)

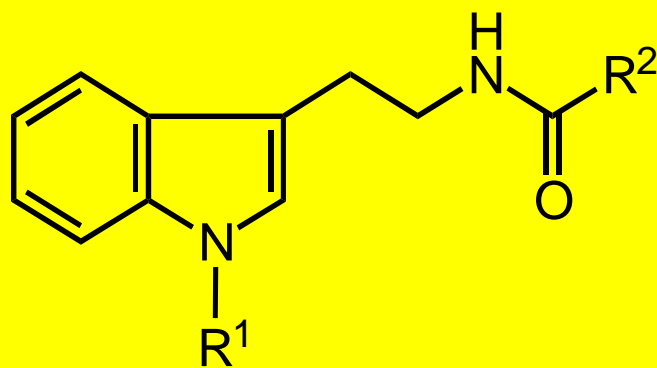


SST-VED化合物の新規性・独創性

染井正徳，重信弘毅，田中芳夫，日本特許第3964417号。

米国特許公開中 [公開日：2009年1月1日。公開番号：2009-0005430]

化学構造式



a: $R^1 = OH$; $R^2 = Alkyl$

染井正徳，日本特許第3795093号

b: $R^1 = H$; $R^2 = Alkyl$

1. R^1 がHである化合物は**天然物**。
2. **物理的、化学的に安定**。
3. **簡単な化学構造かつ低分子量**。
4. 合成が簡単。
5. R^1 が水酸基である化合物は、左記の我々の特許を使用せずに合成できない**独創品**。
6. **α_2 -受容体遮断作用**を有する。

想定される用途

丸4年にわたる、ヤギの繁殖実験で達成された、行動が活発になり、繁殖能力も高まる効果、カシミアの毛の増収という本技術の特徴を生かして

動物では

1. 動物繁殖剤として、畜産業界の興隆に貢献できる。
 - a) 種牛、種豚、種ヤギ、鶏生産分野
 - b) 肉牛、肉豚、乳等の食の供給分野
2. 獣毛繊維業界の興隆に貢献できる。
 - a) カシミア、アルパカ、ピューキーナ
アンゴラうさぎ等、獣毛の増産と質の向上が期待できる。

人間では、

1. ED(勃起不能)治療薬、
2. 育毛・増毛剤、
3. 鬱病改善薬、
としての展開が期待される。



アルパカ

その他、想定される業界

ペット等の業界

- a) ペットの健康維持
- b) 各種血統書付きペットの増産
- c) 優秀な競走馬等の血統維持分野、への展開

医薬分野

- a) ラクダ繁殖 肉、卵増産
- b) 卵から (鶏卵より効率良い) ワクチン (インフルエンザ) 増産

環境問題

- a) 砂漠の緑化 (遊牧民の生活を保障しながらヤギの頭数を減らす)
- b) 絶滅危惧動物 (パンダ、朱鷺など) を増やして、生態系を回復

実用化に向けた課題

ヤギに限らず、牛、豚、羊、馬、犬、猫、鳥類等、全ての動物種について、実施例を増やし、繁殖効果を検討する。 世界の食糧難に対処でき利益は膨大。

人間を対象とする、ED治療薬、育毛・増毛薬の商品化を目指す。 創薬に必要な解決すべき課題は、山積しているが、市場規模は、年間10兆円を超える。

企業への期待

- 今後、非臨床試験、臨床試験、承認申請と審査等に、沢山の時間と資本が必要になります。
- 例えば、様々な安全性試験、長期毒性、遺伝毒性試験、発がん性試験、免疫機構への影響、等々が必要となり、7年から14年位は期間がかかることが予想されます。
- 薬の開発に、忍耐強く挑戦する意欲的な、社会貢献を志向した企業との共同研究を希望します。

本技術に関する知的財産権

発明の名称 : インドール誘導体を有効成分とする 2受容体遮断剤
及び血管拡張剤

出願番号 : 2004-280104 (出願日 : 2004-09-27)

公開番号 : 2006-089443 (公開日 : 2006-04-06)

登録番号 : 03964417 (登録日 : 2007-06-01)

出願人 : 国立大学法人 金沢大学、学校法人 東邦大学

発明者 : 染井正徳、重信弘毅、田中芳夫

産学連携の経歴

2007年 - 2013年

SST-VED化合物群は、

用途の異なる下記の発明と共通の原料である。

故に、大量必要となり、A社と契約し、

工場規模による生産法を確立し、供給体制完了済。

アポトーシス抑制剤

神経細胞現象による疾患、アルツハイマー、

パーキンソン病治療剤：三上剛和、染井正徳、特許番号：特願2008-212044

(出願日：平成20年8月20日)。

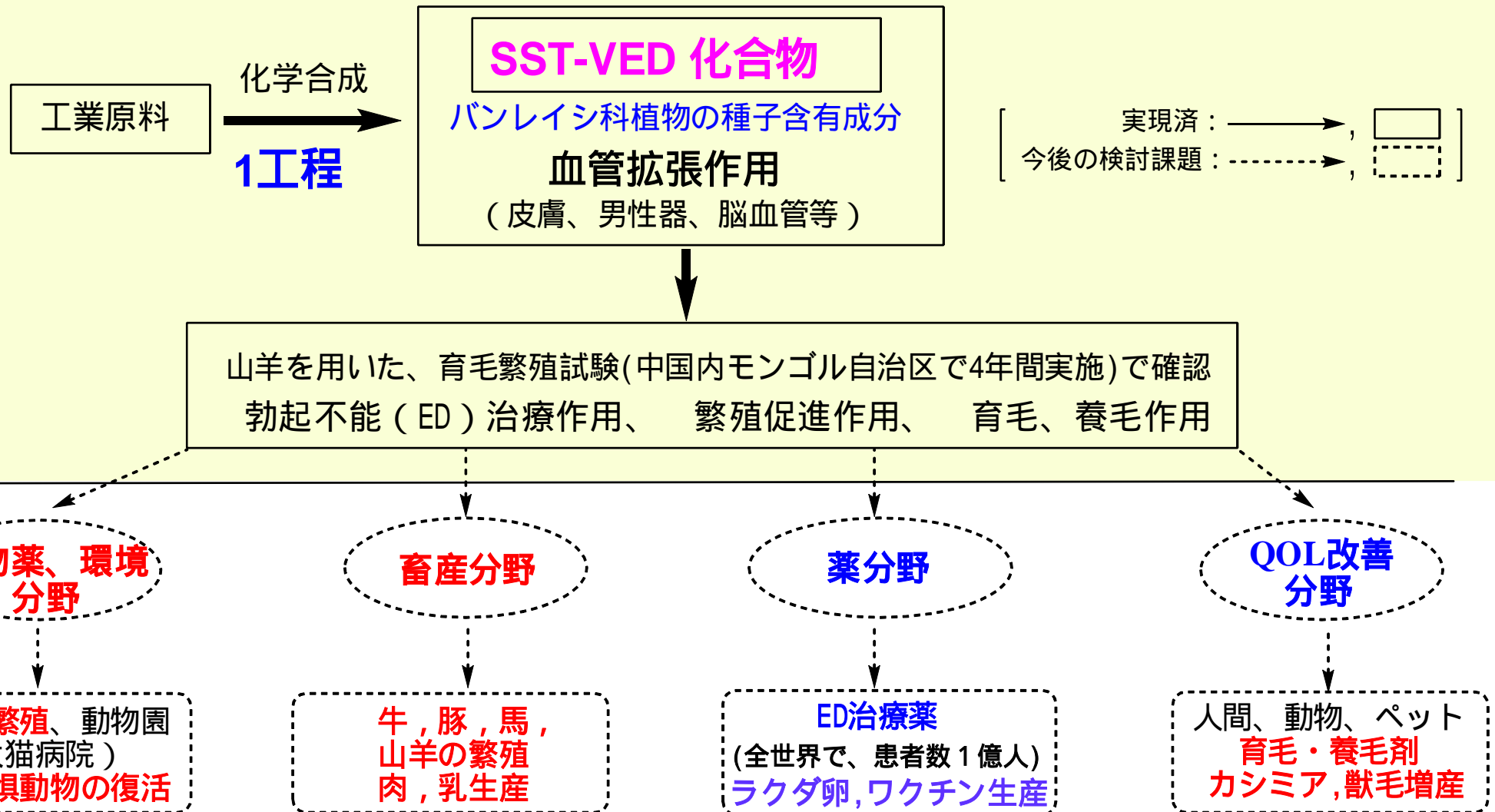
N-アシルトリプタミンを含有する組成物

化粧品として、しみ、吹き出物解消、

創傷、筋肉痛解消剤：染井正徳、特許番号：特願2009-144286

(出願日：平成21年6月17日)。

SST-VED化合物のビジネスプラン



それぞれの分野が、**巨大な市場**
QOLの向上、食糧自給率の改善等の社会貢献を果たしながら
膨大な利益を産む。

お問い合わせ先

(有)金沢大学ティ・エル・オー(KUTLO/キュトロ)
ライセンシング・アソシエイト
中村 尚人

TEL: 076-264-6115 FAX: 076-234-4018

e-mail: e-mail-to@kutlo.incu.kanazawa-u.ac.jp