



2015年7月8日

各位

キョーリン製薬ホールディングス株式会社  
東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地

和光純薬工業株式会社  
大阪市中央区道修町三丁目1番2号

### 杏林製薬株式会社と和光純薬工業株式会社との特許権譲渡契約締結及び 反応性代謝物検出試薬「XenoScreen™ GSH-EE (Tube type)」発売について

キョーリン製薬ホールディングス株式会社(代表取締役社長：穂川稔)の子会社である杏林製薬株式会社(本社：東京都千代田区、代表取締役社長：宮下三朝、以下 杏林製薬)と和光純薬工業株式会社(代表取締役社長：小島伸三、以下 和光純薬)は、杏林製薬が開発した特異体質性薬物毒性(IDT: Idiosyncratic Drug Toxicity)に関与するとされる反応性代謝物を検出する新技術「グルタチオンアルキルエステル同位体置換体および反応性代謝物の検出方法」に関する特許出願(国際出願番号：PCT/JP2012/003302)に係る権利の譲渡契約を締結しました。

杏林製薬は自社が保有する特許権等を製品化などを通して有効活用することを検討していましたが、当契約により知的財産の価値の最大化につながることを期待しています。

和光純薬は杏林製薬から技術導入を行う事により製品化までの開発期間を大幅に短縮し、創薬開発の研究に寄与できる製品を一早く上市することができました。また、薬物動態研究という新たな分野に事業を広げていきます。

当契約を受け和光純薬は、2015年7月に薬物動態研究用 反応性代謝物検出試薬「XenoScreen™ GSH-EE (Tube type)」(以下、本試薬)を発売いたします。

本試薬は、医薬品の開発初期段階において IDT リスク評価を行う為の高感度・高選択的な新規反応性代謝物検出試薬で、反応性代謝物のトラッピング剤としてグルタチオンエチルエステルとその重水素置換体を併用しており、従来法( $[^{13}\text{C}_2, ^{15}\text{N}]\text{GSH}$ )と比較し安価で使いやすくなっています。

また、本試薬のその他の特長としては、以下の点が挙げられます。

- ・反応性代謝物の生成が MS(質量分析計)で特徴的な同位体二重線で検出でき、正確な判定が可能。
- ・エチルエステル体のためイオン化効率が増し、MS で高感度分析が可能。
- ・UPLC/MS と組合せる事により、高速で付加体の検出が可能。
- ・反応性代謝物とトラッピング剤付加体形成に必要な試薬がチューブに調製済みで操作が容易。

以上のように、本試薬は医薬品候補物質の開発初期の IDT リスク評価において有用なトラッピング試薬であり、安全性の高い医薬品の開発に貢献できると期待されます。

本件に関するお問い合わせ先	
キョーリン製薬ホールディングス株式会社 社長室 コーポレートコミュニケーション部 <u>TEL:03-3525-4707</u>	和光純薬工業株式会社 試薬お客様相談室 <u>TEL:0120-052-099</u>

<製品情報>

コード No.	品名	規格	容量	希望納入価格
244-00961	XenoScreen™ GSH-EE (Tube type)	薬物動態研究用	12本	24,000円

<製品写真>



<語句説明>

・特異体質性薬物毒性(IDT : Idiosyncratic Drug Toxicity) : 通常、医薬品が承認されるまでに動物実験や臨床実験において十分な安全性評価がなされるが、極まれに医薬品の上市後、臨床段階では発見できなかった重篤な薬物毒性が発現することがある。これが特異体質性薬物毒性(IDT)と総称される副作用であり、5,000人~10,000人に1人以下の発症率で、薬物の薬理作用とは無関係に発現する性質を有する。IDT発現のメカニズムは明らかになっていないが、その発現に反応性代謝物が関与していると考えられている。

・反応性代謝物 : 医薬品候補物質が生体内で代謝反応を受けて生成する、反応性の高い代謝物である。反応性代謝物の確認方法として、CYP阻害活性測定・トラッピングアッセイ・共有結合性試験等がある。反応性代謝物はIDT惹起物質と考えられている為、製薬企業ではこれらの試験結果を受け医薬品開発を進めるか否かの判断を行う。反応性代謝物を生じる医薬品候補物質を開発初期に排除できれば、IDT発現のリスクを最小化し、より安全な医薬品を提供する事に繋がる。

以上