

調節纖維母細胞生長因子受體3活化的組合物及方法

本院覽號

10A-1051212

公告日期

智財權狀態

美國臨時案已申請、PCT已申請、台灣(發明)I797104已獲證、美國US 11,630,102 B2已獲證、中國已申請、美國已申請、中國已申請

摘要

FGFR3過度活化造成人類遺傳性骨骼發育不全症狀，在體細胞FGFR3過度活化造成癌症。目前尚無有效的治療方法可以治療FGFR3活化突變所引起的骨骼發育不良症狀。我們建立一專一性高通量細胞篩檢系統，篩選出植物萃取物，進一步純化有效成分並分離出純化合物可以抑制FGFR3活化。有效成分已證實可以改善ACH小鼠模型骨骼生長發育，以及抑制FGFR3活化癌細胞生長。這些部分純化有效成分，以及純化合物，可以開發成為FGFR3活化所引起骨骼發育不良和相關的癌症的治療。

技術優勢

目前尚無有效的藥物治療方法可以治療骨骼發育不良症狀。我們使用細胞的易位篩選系統檢測FGFR3活性，從植物萃取物中篩選並純化出抑制FGFR3的活性化合物。在我們所建立的ACH模式小鼠中，證明透過每日餵食ACH疾病小鼠部分純化成分或化學化合物，可以改善長骨和頭骨的發育，並完全改善ACH小鼠的脊柱彎曲。在我們研究中，沒有觀察到這些部分萃取物或化合物具有細胞或動物的毒性。預測將來在臨床試驗上應該會有良好結果。

應用範圍

1. 用此細胞篩選系統，可用於篩選FGFR3配體，激動劑，拮抗劑，和影響活化FGFR3與下游蛋白結合的化合物。
2. ACH小鼠模型可用於進一步評估所篩選到的純化有效成分以及純化合物在生物體內活性，及毒性。評估將來藥物在人類FGFR3過度活化骨骼發育不良的潛在治療。
3. 透過這篩選方法以及在ACH小鼠評估的植物萃取物，活性成份，跟純化化合物，預計將來在臨床上治療FGFR3活化骨骼發育不全和相關的人類癌症，應該會有良好結果。

創作人

陳垣崇、李宜靜、鄔哲源、高曉容



中央研究院
ACADEMIA SINICA