

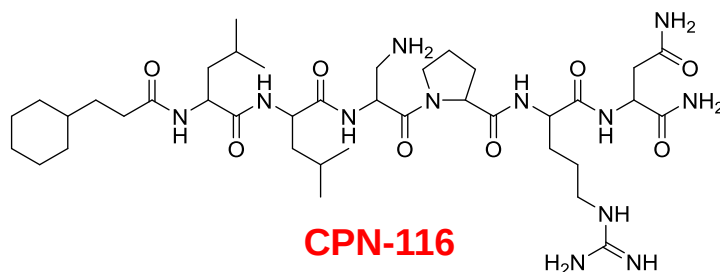
Neuromedin U 受容体2 選択的アゴニスト

CPN-116

および 関連ペプチド

Neuromedin U (NMU) は、1985年に国立循環器病センターの南野らにより、子宮筋収縮作用を指標として、ブタ脊髄より発見された神経ペプチドです¹⁾。NMUの受容体には、1型(NMUR1)および2型(NMUR2)の2つのG蛋白質共役型受容体が知られています²⁾。NMUは、摂食抑制、体重減少への関与が示唆されていることから、創薬候補分子として注目を集めています³⁾。NMU受容体の内因性リガンドとして、より強力な摂食抑制作用を示す Neuromedin S が後に国立循環器病センターの森らにより同定されました⁴⁾。しかしながら最近まで、これら各受容体への特異的なアゴニストの報告はなく、Neuromedin U / Neuromedin S の詳細な生理機能に関しては、未知なる部分が数多く存在しています。

近年、東京薬科大学の高山らは、NMUの構造活性相関研究により、NMUR2選択的アゴニスト **CPN-116** の創製に成功しました⁵⁾。本アゴニストは、1 μ M以下の濃度で1型受容体は活性化せず、2型受容体に対して高いアゴニスト活性を示しました。すなわち2型受容体に対して高度に選択的なアゴニスト(EC₅₀ 6.4 $\pm$ 1 nM)として作用します。なお、この活性値は、human NMU(EC₅₀ 2.5 $\pm$ 0.5 nM)と比べて2-3倍劣るものの小分子としては強力なものであり、今後創薬分子として注目を集めています。

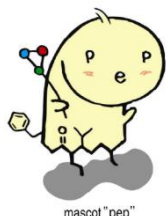


CPN-116

参考文献

- 1) N. Minamino, K. Kangawa, and H. Matsuo, *Biochem. Biophys. Res. Commun.*, **130**, 1078 (1985).
- 2) P.J. Brighton, P.G. Szekeres, and G.B. Willars, *Pharmacol. Rev.*, **56**, 231 (2004).
- 3) V.G. Martinez, and L. O'Driscoll, *Clin. Chem.*, **61**, 471 (2015).
- 4) K. Mori, M. Miyazato, T. Ida, N. Murakami, R. Serino, Y. Ueta, M. Kojima, and K. Kangawa, *EMBO J.*, **24**, 325 (2005).
- 5) K. Takayama, K. Mori, K. Taketa, A. Taguchi, F. Yakushiji, N. Minamino, M. Miyazato, K. Kangawa, and Y. Hayashi, *J. Med. Chem.*, **57**, 6583 (2014).

	コード	品名	容量	価格
New	3408-v	CPN-116 (Selective Agonist for NMUR2)	0.5mg vial	¥ 10,000
New	4490-v	Neuromedin U (Human)	0.5 mg vial	¥ 20,000
New	4491-v	Neuromedin U (Mouse)	0.5 mg vial	¥ 20,000
	4377-v	Neuromedin U (Rat)	0.5 mg vial	¥ 20,000
	4426-s	Neuromedin S (Human)	0.1 mg vial	¥ 11,000
	4427-s	Neuromedin S (Rat)	0.1 mg vial	¥ 12,000



株式会社 ペプチド研究所

電話: 072-643-4480

<https://www.peptide.co.jp>

FAX: 072-643-4422

E-mail: sales@peptide.co.jp