

Presseinformation

IP Bewertungs AG (IPB) präsentiert Innovationen aus dem Bereich Pharma

Chemo-enzymatische Synthese von Zyklischen Peptiden ermöglicht hocheffizientes Screening

Hamburg, 14. Juli 2009: In einem neuen Forschungsprojekt wird derzeit ein Verfahren zur schnelleren und effizienteren Erzeugung von kombinatorischen Bibliotheken zur kommerziellen Reife gebracht. Durch die chemo-enzymatische Synthese pharmakologisch hochwirksamer zyklischer Peptide werden Tests auf geeignete Wirkstoffkandidaten wesentlich verbessert. Das große Potential von zyklischen Peptiden als ideale Leitstrukturen zur Wirkstofferkennung konnte bislang nicht ausgeschöpft werden, da geeignete Technologien fehlten. In einem von der IP Bewertungs AG (IPB) betreuten Projekt werden nun die Werkzeuge zur Generierung maßgeschneiderter kombinatorischer Bibliotheken entwickelt und stehen schon bald zur exklusiven Nutzung zur Verfügung.

Zyklische Peptide gehören in der Medizin zu wichtigen Wirkstoffen im Kampf gegen pathogene Keime und Pilze oder bei Krebsbehandlungen und sind damit gerade bei der Entwicklung neuer Medikamente von außerordentlicher Relevanz. Seit 1980 stammen etwa zwei Drittel aller neuzugelassenen Medikamente aus dem Bereich der Naturstoffe oder der Naturstoff-verwandten Substanzen. Prominente Vertreter sind die zyklischen Peptid-Antibiotika Daptomycin und Pristinamycin, die im Jahr 2008 einen Umsatz von 450 Mio. USD bzw. 160 Mio. USD weltweit erzielen. Bei den Antimykotika sind die Echinocandine ein erfolgreiches Beispiel – allein der Wirkstoff Caspofungin generierte im letzten Jahr einen Umsatz von 550 Mio. USD weltweit.

Zyklische Peptide werden in der Natur von unterschiedlichsten Mikroorganismen produziert. Dabei erfolgt die Biosynthese nicht an den üblichen Synthese-Maschinerien, den Ribosomen, sondern an großen Multienzymkomplexen. Dieser Umstand verleiht der Substanzklasse von Natur aus eine relativ hohe strukturelle Vielfalt. Neben den bekannten 20 kanonischen Aminosäuren kommen noch eine ganze Reihe weiterer Amino- und Hydroxysäuren, insgesamt ca. 300 verschiedene, als Bausteine für den Einsatz in Frage. Diese Vielfalt führt bisher zu zeit- und kostenaufwändigen Synthesen und damit zu einer langwierigen Kandidatensuche oder verhindert diese gänzlich.

Bei der neuen innovativen Methode der chemo-enzymatischen Synthese wird zunächst ein lineares Vorläufer-Molekül synthetisiert, das nachfolgend an eine reaktive Abgangsgruppe gekoppelt und abschließend Enzym-katalysiert – und somit mit höchster Regio- und Stereoselektivität – in das aktive, zyklische Peptid umgewandelt wird. Da während des Prozesses keinerlei Restriktionen hinsichtlich der verwendbaren Bausteine bestehen, ist die Anwendung dieser neuen Synthesemethode sehr attraktiv. Der entscheidende Proof-of-Concept für die

Optimierung der Eigenschaften eines zyklischen Peptids wurde bereits für das Antibiotikum Tyrocidin A erbracht. In einer relativ kleinen Bibliothek von weniger als 200 Struktur-Varianten konnten mit extrem hoher Trefferquote (>3%; Standard-Verfahren im Vergleich: <0,01%) Derivate mit deutlich verbessertem therapeutischen Index (>40-fach) identifiziert werden. Aufgrund der guten Wirksamkeit der natürlichen Ausgangsverbindungen kann das innovative Verfahren mit vergleichbarer Effizienz für die Optimierung unterschiedlichster, zyklischer Peptid-Wirkstoffe eingesetzt werden.

Für weitere aktuelle Informationen aus dem Technologieportfolio im Bereich Biotech/ Pharma stehen wir gern zur Verfügung

Ansprechpartner der IP Bewertungs AG (IPB):
Dr. Atilla Coksezen
Sales Manager
Tel: 040 – 87 87 90 – 00
biotechpharma@ipb-ag.com

Über die IP Bewertungs AG (IPB)

Die IP Bewertungs AG (IPB) zeichnet sich durch technisches Know-how, Qualität und die innovative Weiterentwicklung von Technologien aus. Zusammen mit Professoren, Forschungsinstituten und Ingenieurbüros bilden die Patentspezialisten eines der größten F&E-Netzwerke Deutschlands und entwickeln marktgängige Lösungen aus innovativen Ideen.

Das Hamburger Unternehmen beschäftigt in der Zentrale in Hamburg 80 Mitarbeiter. Die meisten der Naturwissenschaftler und Ingenieure arbeiten im Patentmanagement und sind in beratender Funktion für Patentverwertungsfonds tätig. Die IPB ist eines der führenden Beratungsunternehmen in Europa für ein ganzheitliches Patentmanagement. Sie berät ihre Mandanten in allen Fragen rund um die Patentbewertung und –verwertung.

Pressekontakt:

IP BEWERTUNGS AG (IPB)

Ulrike Schulz
Stephansplatz 10
D-20354 Hamburg

Tel: +49 40 8787 90-423
Fax: +49 40 8787 90-122
Email: SCHULZ@ipb-ag.com