



2020年4月7日

(以下は Cullgen Inc. による英文プレスリリースの日本語訳です)

## Cullgen 低分子 BRAF タンパク質分解剤についての Journal of Medicinal Chemistry 誌 論文掲載を発表

独自の標的タンパク質分解技術である uSMITE™プラットフォームを使った低分子治療薬を開発する当社子会社の Cullgen Inc. (米国、サンディエゴ、以下、Cullgen という) は、本日、主要な BRAF 変異タンパク質を標的とする選択的分解剤開発が Journal of Medicinal Chemistry 誌へ掲載許諾されたことを発表しました。正常な細胞シグナル伝達および細胞増殖機能に必要な BRAF タンパク質は、メラノーマ(悪性黒色腫)、大腸がん、および甲状腺がんを含むヒト癌において最も頻繁に変異する遺伝子の1つであります。

Cullgen によって開発された分解剤は、病気によって形成される変異 BRAF タンパク質と癌細胞増殖を効率的に分解します。

米国国立癌研究所によると、米国では2019年に新たに96,000人以上の悪性黒色腫症例が報告されています。大腸癌は、米国で毎年診断される癌の中で4番目に多く、2019年には145,000人超の新たな症例と51,000人の死亡報告がされています。これら BRAF 変異に起因する腫瘍患者に向けての有望な新規治療薬が待ち望まれております。

Cullgen の会長兼社長でもあるイン・ルオ博士は「この研究成果は、uSMITE™における新たな選択性の高い分解剤を開発する技術的な有意性を示すと共に、メラノーマ(悪性黒色腫)や大腸癌などの衰弱性疾患治療への貢献を示している。また、現在開発途中である前臨床段階の複数の腫瘍分解剤開発に加え、uSMITE™のプラットフォームを活用することにより、全く新しい標的タンパク質分解剤を導く新規 E3 リガンドの発見が可能となる」としています。

Journal of Medicinal Chemistry は、American Chemical Society(ACS)によって創刊された査読済み科学および医学雑誌です。この雑誌は、分子構造と生物活性または作用機序との関係の理解に寄与する革新的な研究を発表しています。

Cullgen について：

Cullgen は有効な治療アプローチを欠く疾患治療のための画期的な新規化学物質(NCE)の開発を目指すバイオテクノロジー企業。ユビキチンを介した低分子標的除去技術(uSMITE™)という独自の技術プラットフォームを開発している。これまでの薬剤はタンパク質の機能部位と相互作用し、活性化を阻害するように設計されているが、uSMITE™は、機能部位阻害にとどまらず創薬パラダイムを広げ、これまで「凝集できなかった」酵素やタンパク質を標的破壊で排除することが可能。さらに、uSMITE™技術を活用し、すべての細胞でのタンパク質の分解を制御する多段階生化学プロセスであるユビキチン・プロテアソームシステムを利用することを目指す。Cullgen 社の創立者は、すでにこうした選択的で生物学的に利用可能な多数の化合物を迅速に生成できることを実証している。しかもこの生成プロセスは従前の創薬アプローチと比べ大幅な費用対効果の向上が見込める。(詳細は、[www.cullgen.com](http://www.cullgen.com) (英語サイト)を参照。)

以上