

WuXi AppTecによるDELを用いた創薬探索研究 支援サービスのご紹介

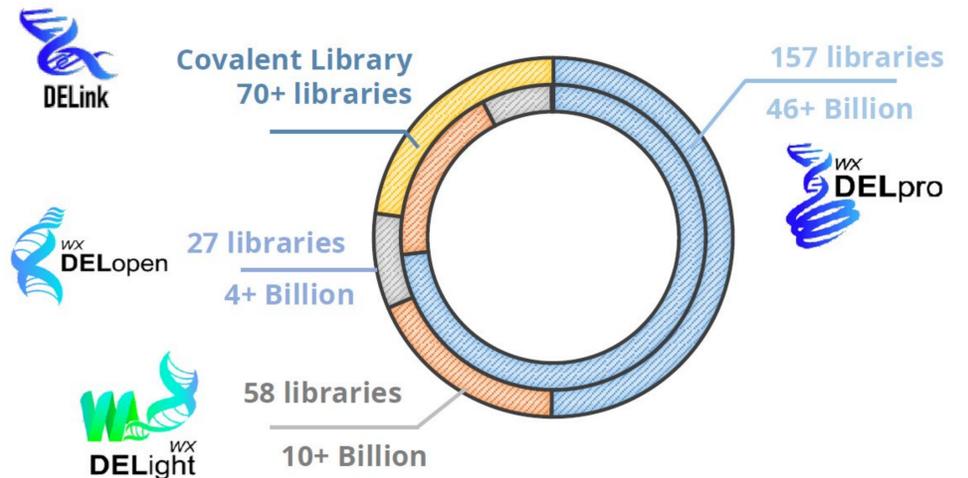


伊藤 文雄 (Business Development, WuXi AppTec Japan)

WuXi AppTec のDNA-Encoded Library



現在100億化合物程度のライブラリを構築しており、最近では**Covalent Inhibitor**を志向したライブラリや**RNA**を標的とするライブラリとスクリーニングについてもサービスとしてリリースしています。



DELを用いたサービスについて

3つのサービスをリリースしています。

DELproとDELightは主に製薬会社向けのサービスでライブラリの規模、アフィニティスクリーニングの実施場所、結合親和性のあるヒット化合物の選抜方法、オフDNA化合物の合成数などに違いがあります。

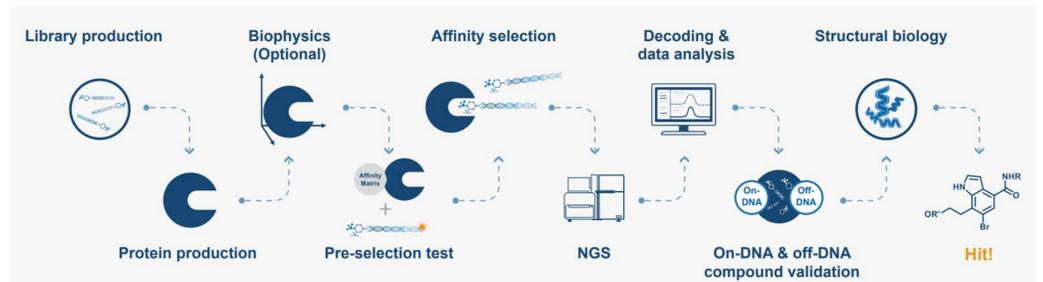
DELpro

製薬企業向けサービス



Fixed Fee

クライアントからタンパク質の情報を開示
WuXiのサイトにてスクリーニング
ヒットは両社で協議し選抜
オフDNA化合物の再合成 (20化合物)



DELight

製薬企業向けサービス



10+ Billion

キットの料金とヒット化合物の構造開示費用
クライアントの施設にて実験実施のためタン
パク質の情報開示の必要なし
WuXiのサイトにてデコンボリューション
ヒットは両社で協議し選抜



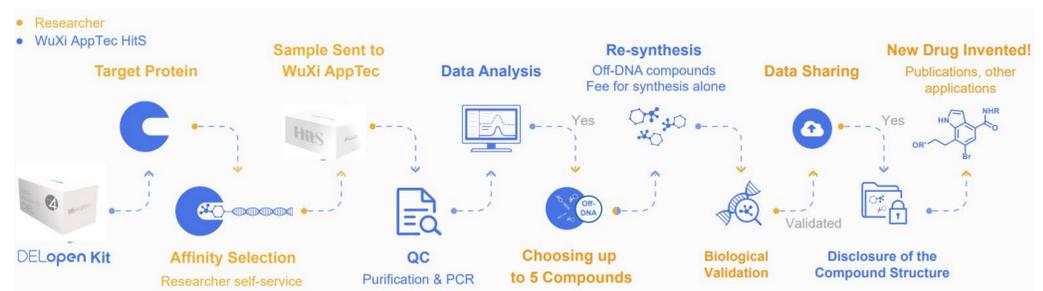
DELopen

アカデミア向けサービス



4+ Billion

キットは無償提供
クライアントの施設にて実験実施のためタン
パク質の情報開示の必要なし
ヒットは両社で協議し選抜
有償にてオフDNA化合物の再合成 (5化合物
まで)



弊社DEL活用による実績の一例

Negative allosteric modulation of the μ -opioid receptor

DNA-encoded libraries from WuXi AppTec were used in a "steered" screening against either inactive or active μ -opioid receptors in parallel, to find novel negative allosteric modulators of this receptor. The molecule discovered via DEL screening not only shows direct and effective in vitro and in vivo potency, but also helps elucidate the mechanism of negative allosteric modulation of GPCRs.



Discovery of Novel GST Inhibitors Identified from a DNA-Encoded Library

WuXi AppTec scientists recently contributed to a study which led to the discovery and optimization of a novel series of GST inhibitors. The authors used affinity mediated DEL selection against a privileged scaffold to identify a compound with potent inhibition against SjGST and GSTM2.

