



株式会社スコヒアファーマ

2019年9月5日

新規エンテロペプチダーゼ阻害薬(SCO-792)の 化合物特性に関する論文掲載について

株式会社スコヒアファーマおよび武田薬品工業株式会社の研究グループは新規エンテロペプチダーゼ阻害薬である SCO-792 の化合物特性に関する報告を行いました。この研究成果は、2019年9月5日に「Pharmacology Research & Perspectives」でオンライン公開されました。

論文名

Discovery and characterization of a small-molecule enteropeptidase inhibitor, SCO-792

<https://doi.org/10.1002/prp2.517>

エンテロペプチダーゼは十二指腸に特異的に存在するセリンプロテアーゼであり、タンパク質の消化プロセスにおいて主要な役割を担っています。当社は現在、エンテロペプチダーゼ阻害薬である SCO-792 の研究開発を進めています。

今研究では、まず SCO-792 の同定につながったスクリーニングシステムについて報告しました。次に SCO-792 の *in vitro* における化合物特性について検討し、SCO-792 はラットおよびヒトエンテロペプチダーゼに対してそれぞれ 4.6 nM および 5.4 nM の IC₅₀(50%阻害濃度)値を伴う強い阻害活性を示すことを示しました。さらに SCO-792 によるエンテロペプチダーゼ阻害は、反応時間依存的に増強されることを示しました。また、*in vitro* において、エンテロペプチダーゼに結合した SCO-792 は非常にゆっくりと乖離した(約 14 時間の dissociation half-life)ことから可逆的な阻害特性を有すると考えられました。以上の *in vitro* 特性を有する SCO-792 をラットに単回経口投与したところ、腸管から血中へのタンパク吸収が抑制されました。

これまでに我々を含む研究グループは、エンテロペプチダーゼ阻害薬である SCO-792 が前臨床試験において強力な肥満および糖尿病を改善する作用を有することを示しています(過去のリリースは[こちら](#))。今回の結果と合わせ、SCO-792 が臨床において有用な治療効果を発揮することが期待されます。

以上

本件に関するお問い合わせ先：info@scohia.com