

# 文部科学大臣賞

## がん抑制遺伝子の再活性化による がん治療薬トラメチニブの発見

### <受賞者>

酒井 敏行（京都府立医科大学大学院医学研究科分子標的癌予防医学 教授）

### <功績>

酒井氏は、がん抑制遺伝子の再活性化に着目した分子標的薬のスクリーニング法を開発し、製薬企業と共同で画期的ながん分子標的薬であるトラメチニブを発見した。トラメチニブはBRAF変異メラノーマ（悪性黒色腫）等に著効を示し、第一選択薬として60カ国以上で使用されており、がんの克服に多大な貢献を果たした。

### <概要>

酒井氏は、がん抑制遺伝子であるRBが不活性化して発がんに至ることを発見した。またRBに着目して、RB再活性化物質をスクリーニングする手法を開発し、同法を用いて製薬企業と共同で化合物探索を行い、これまで有効な阻害剤が存在しなかったMEK阻害剤トラメチニブ等を発見した。トラメチニブは、進行性BRAF変異メラノーマ（悪性黒色腫）の患者に対し、既存薬に比べて著しく高い治療効果を示し、2013年にファースト・イン・クラス（世界初承認の画期的医薬品）かつベスト・イン・クラス（既存薬に対して明確な優位性を持つ医薬品）のがん分子標的薬（MEK阻害剤）として米国で承認され、現在、我が国を含む60カ国以上で第一選択薬として使用されている。

メラノーマは難治性の皮膚がん、欧米では日本の約10倍の頻度であり、国際的に最も深刻ながんの一つとされている。トラメチニブはメラノーマ以外のがんにも治療効果を示し、世界のがん克服に大きく貢献している。

### <参考>

#### RB再活性化スクリーニングの一例



#### RB再活性化スクリーニングの成果

