

内閣総理大臣賞

エスジーエルティーツー

SGLT2の分子同定とその阻害薬の開発

<受賞者>

金井 好克 (大阪大学 医学系研究科 教授)
田辺三菱製薬株式会社

<功績>

金井氏は腎臓で糖再吸収を担うタンパク質である「SGLT2」を同定し、田辺三菱製薬株式会社と共に、SGLT2の機能を阻害することにより糖の再吸収を抑え血糖値を下げる新たな作用機序の2型糖尿病治療薬のコンセプトを検証。同社は2型糖尿病治療剤として実用化し、同剤は世界各国で使用されている。

<概要>

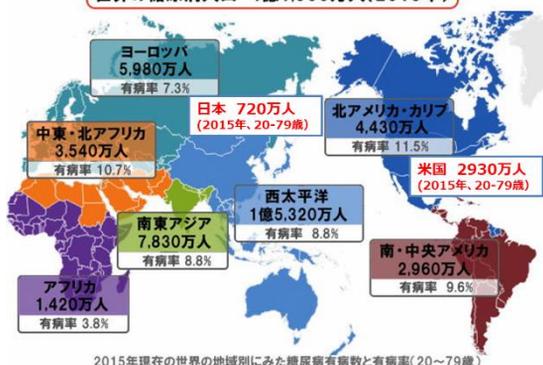
血中の糖（グルコース）は腎臓の糸球体で老廃物とともに濾過される。健常者の場合、濾過されたほとんどの糖が尿細管壁に存在するタンパク質により再吸収され血中に戻されるが、糖尿病患者においては、高血糖のため糖の再吸収が飽和状態となり、尿への糖排泄が血糖値に応じて増加する。

金井氏は、腎臓での糖再吸収を担うタンパク質である「SGLT2」を同定し、田辺三菱製薬株式会社と共に、SGLT2の機能を抑制することで尿中への糖の排泄が促進され、血糖値が低下する効果が得られることを確認した。また、同社は、SGLT2阻害薬であるカナグリフロジンを、2型糖尿病治療剤として完成させた（2013年米国、欧州で製造販売承認。2014年7月に日本で製造販売承認）。

同剤は、「尿中に糖が出る」病気を「尿中に糖を出す」薬剤にて治療する、という逆転の発想から生まれたまったく新しい2型糖尿病治療剤であり、世界88カ国以上の国と地域で承認され、ブロックバスター※となった米国を始めとして世界各国で使用されている。

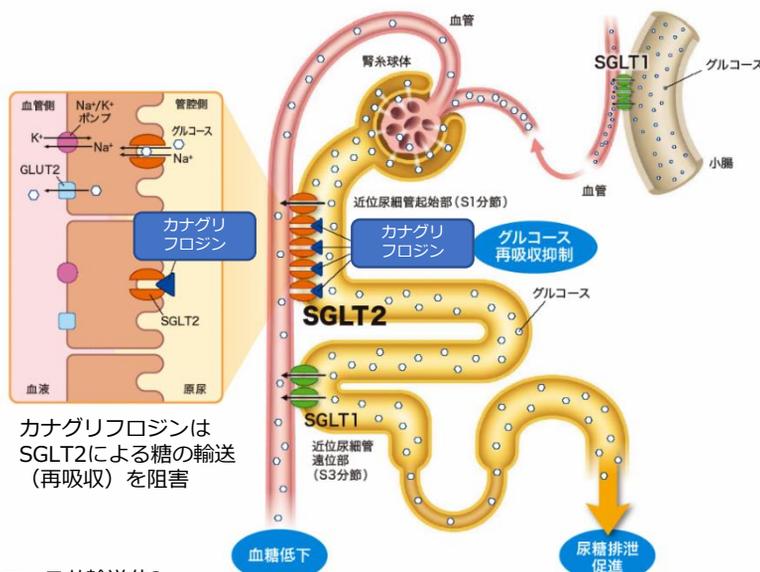
日本を含む西太平洋地区は世界最大の糖尿病人口を抱える

世界の糖尿病人口 4億1,500万人(2015年)



2015年現在の世界の地域別にみた糖尿病有病数と有病率(20-79歳)

腎尿細管のタンパク質SGLTは糖を再吸収し血中に戻す



カナグリフロジンはSGLT2による糖の輸送(再吸収)を阻害

※SGLT2 : sodium glucose co-transporter 2, ナトリウム-グルコース共輸送体2

※ブロックバスター : これまでにない新しい発想で作られた画期的新薬であり、その対象疾患領域において突出した売り上げを誇る医薬品。通常、全世界における年間売上高が10億ドル以上の医薬品をブロックバスターと呼ぶ。