

## Drug Discovery & Development of Kinase Inhibitor

宮田 直樹<sup>1</sup>

<sup>1</sup>名市大院薬

21世紀は、チロシンキナーゼ阻害剤イマチニブ（グリベック）の上市で幕が開けた。イマチニブは、慢性骨髄性白血病、KIT（CD117）陽性消化管間質腫瘍、フィラデルフィア染色体陽性急性リンパ性白血病、FIP1L1-PDGFR $\alpha$ 陽性の好酸球增多症候群や慢性好酸球性白血病等を効能として臨床に供されている。癌細胞ではそれぞれ特定のチロシンキナーゼが細胞増殖に関与していることから、現在までにニロチニブ、ゲフィチニブ、エルロチニブ、ダサチニブ、ラバチニブ、スニチニブ、アキシチニブ、クリゾチニブなど多くの低分子チロシンキナーゼ阻害薬が種々の腫瘍の治療薬として開発されている。加えて、同じ受容体型チロシンキナーゼを標的とする抗体医薬として、セツキシマブ、ベバシズマブ、ラニビズマブ、パニツムマブなどの抗腫瘍性抗体医薬も上市されている。今回のPSJ-PSKジョイントシンポジウムでは、チロシンキナーゼ阻害薬の現状と展望に焦点を当て、新しいチロシンキナーゼ阻害剤の合理的デザインと合成、複数のチロシンキナーゼ受容体に作用する医薬品の開発、チロシンキナーゼ阻害剤の腫瘍以外の疾患への適応の可能性などについて、日韓の4人の先導的研究者が話題を提供する。