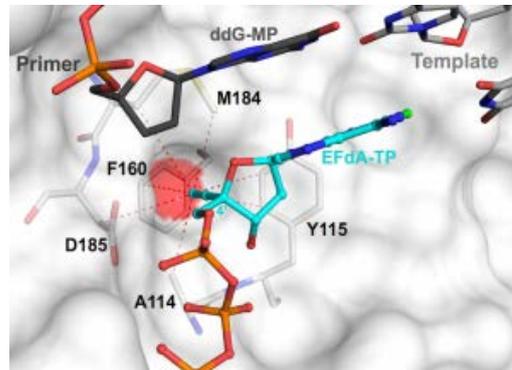


薬剤耐性 HIV に効果を示す新薬候補の機序を国際共同研究で解明しました(2016/8/16)

テーマ：災害時も役立つ創薬研究における国際共同研究成果
URL：<http://www.pnas.org/>

8月16日、災害科学国際研究所 災害医学研究部門 災害感染症学分野の児玉栄一教授は、新しい抗 HIV（後天性免疫不全ウイルス）薬候補（EFdA/MK-8591）が、どのようにして薬剤耐性 HIV の複製を抑えるのかをミズーリ大学、熊本大学、ピッツバーグ大学などとのタンパク構造を解析する国際共同研究によって明らかにしました。

研究成果は米国アカデミー紀要（*Proceedings of National Academy of Science of the U.S.A.*）に掲載されています。図に示したように EFdA/MK-8591（中心部のシアン）は、HIV 複製に必須な逆転写酵素（背面の灰色）に疎水性と親水性の2つの相反する結合を介して逆転写酵素の構造にひずみを起し、その働きを抑えます。



EFdA/MK-8591 は現在米国メルク社によって臨床開発されている薬剤です。たった1錠の服用で1週間以上の効果が臨床試験で明らかになりました。さらに徐放効果を有する注射剤にすると一度の注射で6か月以上、効果が持続することも、サルとヒトで示されています。これまで毎日複数の薬剤を継続して服用しなければならなかった HIV 感染症の治療を大きく変えることが期待されています。長期作用効果により、災害時の急性期で薬剤服用が困難であっても、その影響が最小限になると考えられます。災害時にも大いに活躍する薬剤になるでしょう。

【補足】

HIV は免疫に重要なリンパ球に感染、破壊するため本来なら自分の力で抑えることのできる感染症を抑えられなくなります。近年、複数の薬剤を併用することで、免疫力の回復や HIV 感染者からの感染拡大も阻止できるようになりました。しかし、薬剤耐性 HIV の出現、服薬しなければならぬ錠数の増加、服薬の継続が問題になっています。

逆転写酵素は HIV がゲノムとして用いる RNA を DNA に変換するときに用いられるウイルス由来の重要な酵素です。一般的に HIV 感染症治療には3種類の薬剤を組み合わせてますが、その中でも逆転写酵素阻害剤は、欠かすことのできない中心的な薬剤です。

掲載雑誌：Proceedings of the National Academy of Sciences of the United States of America

タイトル：Structural basis of HIV inhibition by translocation-defective RT inhibitor 4'-ethynyl-2-fluoro-2'-deoxyadenosine (EFdA)