

14. 主要開発品（パイプライン）

＜自社開発品一覧＞

品目／開発コード	効能追加等**	開発ステージ***	領域
承認取得品			
○ ハラヴェン（脂肪肉腫）	効能	（欧）承認	がん
○ フィコンバ（経口懸濁液）	剤形	（米欧）承認	神経
○ レンビマ/Kispalyx（腎細胞がん・セカンドライン）	効能	（米欧ア）承認	がん
○ Belvia（1日1回製剤）	剤形	（米）承認	神経
○ ヒュミラ（非感染性ぶどう膜炎）	効能	（日）承認	その他
申請中・申請準備中開発品			
アリセプト（高度アルツハイマー型認知症）	効能	（中）申請	神経
○ ハラヴェン（乳がん）		（中）申請	がん
○ AJG511（潰瘍性大腸炎）*		（日）申請	消化器
○ バリエット（PPI 抵抗性逆流性食道炎に対する維持療法）	用法	（日）申請	消化器
○ フィコンバ（部分てんかん単剤療法）	効能	（米）申請	神経
◎ AJG533（慢性便秘症）*		（日）申請	消化器
臨床試験中開発品			
○ E2006（不眠障害）		（日米欧）PⅢ	神経
○ E2609（早期アルツハイマー病）		（日米欧）PⅢ	神経
◎ レンビマ（甲状腺がん）		（中）PⅢ	がん
AJM300（潰瘍性大腸炎）*		（日）PⅢ	消化器
AJG555（慢性便秘症）*		（日）PⅢ	消化器
リーバクト（低アルブミン血症）		（中）PⅢ	消化器
○ フィコンバ（レノックス・ガストロー症候群）	効能	（日米欧）PⅢ	神経
○ フィコンバ（てんかん小児適応）	効能	（日米欧）PⅢ	神経
◎ フィコンバ（部分てんかん単剤療法）	効能	（日）PⅢ	神経
レンビマ（肝細胞がん）	効能	（日米欧中ア）PⅢ	がん
○ レンビマ（腎細胞がん・ファーストライン）	効能	（米欧）PⅢ	がん
BAN2401（アルツハイマー型認知症）		（日米欧）PⅡ	神経
○ E2006（アルツハイマー型認知症に伴う不規則睡眠覚醒リズム障害）		（日米）PⅡ	神経
MORAb-003（プラチナ感受性卵巣がん）		（日米欧）PⅡ	がん
MORAb-004（メラノーマ）		（米欧）PⅡ	がん
MORAb-009（中皮腫）		（米欧）PⅡ	がん
E7777（末梢性T細胞リンパ腫、皮膚T細胞性リンパ腫）		（日）PⅡ	がん
ハラヴェン（乳がん・抗PD-1抗体ベムプロリスマブとの併用療法）		（米）PⅠ/Ⅱ	がん
◎ レンビマ（固形がん・抗PD-1抗体ベムプロリスマブとの併用療法）		（米）PⅠ/Ⅱ（日）PⅠ	がん
○ E6007（潰瘍性大腸炎）*		（日）PⅡ	消化器
○ E6011（関節リウマチ）		（日）PⅡ	その他
○ E6011（原発性胆汁性胆管炎）*		（日）PⅡ	その他
アリセプト（ダウン症候群の退行様症状）	効能	（日）PⅡ	神経
ハラヴェン（膀胱がん）	効能	（米欧）PⅠ/Ⅱ	がん
レンビマ（非小細胞肺癌 RET 転座）	効能	（日米欧ア）PⅡ	がん
レンビマ（胆道がん）	効能	（日）PⅡ	がん
○ ハラヴェン（乳がん・PEGPH20との併用療法）		（米）PⅠ/Ⅱ	がん
E6011（クローン病）*		（日）PⅠ/Ⅱ	その他
Belvia（肥満症）		（日）PⅠ	神経
E2027（アルツハイマー型認知症）		（米）PⅠ	神経
◎ E2730（てんかん）		（米）PⅠ	神経
E7090（固形がん）		（日）PⅠ	がん
MORAb-066（固形がん）		（米）PⅠ	がん
E7046（固形がん）		（米欧）PⅠ	がん
○ H3B-6527（肝細胞がん）		（米）PⅠ	がん
○ H3B-8800（血液がん）		（米欧）PⅠ	がん
○ E7438（B細胞性非ホジキンリンパ腫）		（日）PⅠ	がん
○ E6130（炎症性腸疾患）*		（日）PⅠ	消化器
MORAb-022（関節リウマチ）		（米）PⅠ	その他
E6071（自己免疫疾患）		（欧）PⅠ	その他
レンビマ（腎細胞がん・セカンドライン）	効能	（日）PⅠ	がん
ハラヴェン（リボソーム製剤）	剤形	（欧）PⅠ	がん

* EA ファーマ開発品、** 効能：効能効果追加、剤形：剤形追加、用法：用法用量追加

*** 日：日本、米：米国、欧：欧州、中：中国、ア：日本・中国を除くアジア P = Phase：臨床試験段階

○アリセプトのバッチ製剤について開発主体が帝國製薬に変更となったため、本表から削除しました。

◎MORAb-004について、フェーズⅡ段階にあった大腸がんおよび悪性軟部腫瘍を対象とした適応の開発を中止しました。

◎レンビマのフェーズⅡ段階にあった子宮内膜がん（単剤療法）、メラノーマおよび非小細胞肺癌（サードライン・単剤療法）を対象とした適応の開発を中止しました。

◎ハラヴェンについて、フェーズⅢ段階にあった非小細胞肺癌を対象とした適応の開発を中止しました。

◎E7820について、フェーズⅡ段階にあった大腸がんを対象とした適応の開発を中止しました。

◎MORAb-003について、フェーズⅡ段階にあった非小細胞肺癌を対象とした適応の開発を中止しました。

○：2016年4月以降の進捗、◎：2017年1月以降の進捗

(1) 神経

開発品コード：E2020 一般名：ドネペジル 製品名：アリセプト

薬効／作用機序：アルツハイマー型、レビー小体型認知症治療剤			自社品
[概要] 神経伝達物質のアセチルコリンを分解する酵素であるアセチルコリンエステラーゼを阻害することにより、脳内アセチルコリン濃度を高め、アルツハイマー型認知症（AD）の認知症症状の進行を抑制します。軽度および中等度のAD治療剤として、世界90カ国以上で承認されており、米国、日本、カナダ、中南米やアジアの一部の国などでは高度ADにも承認されています。日本とフィリピンにおいてはレビー小体型認知症の適応も取得しています。			
高度アルツハイマー型認知症（効能追加）	339試験	中国 申請（2015年2月）	経口剤
ダウン症候群の退行様症状（効能追加）	345試験	日本 PII	経口剤

○パッチ製剤について開発主体が帝國製薬に変更となったため、本表から削除しました。

開発品コード：E2007 一般名：ペランパネル 製品名：フィコンパ/Fycompa

薬効／作用機序：抗てんかん剤／AMPA受容体拮抗剤			自社品
[概要] グルタミン酸受容体のサブタイプであるAMPA受容体へのグルタミン酸の結合を選択的に阻害します。部分てんかんの併用療法に対して日本、欧州、米国およびアジアなど、55カ国以上で承認を取得しています。また、全般てんかんの強直間代発作の併用療法の適応についても、日本、米国、欧州などで承認を取得しています。			
経口懸濁液（剤形追加）		○ 米国 承認（2016年4月） ○ 欧州 承認（2016年9月）	経口剤
部分てんかん単剤療法（効能追加）	— 342試験	○ 米国 申請（2016年9月） ◎ 日本 PIII	経口剤
○ レノックス・ガストー症候群（効能追加）	338試験	日米欧 PIII	経口剤
○ てんかん小児適応（効能追加）	311試験	日米欧 PIII	経口剤

開発品コード：E2006 一般名：lemborexant

薬効／作用機序：オレキシン受容体拮抗剤			自社品
[概要] 睡眠と覚醒の調整に関与するオレキシンの受容体に拮抗することで、覚醒状態を鎮め、自然な睡眠の誘発・維持を期待しています。			
○ 不眠障害	304試験	日米欧 PIII	Purdue Pharmaと共同開発 経口剤
○ アルツハイマー型認知症に伴う不規則睡眠覚醒リズム障害	202試験	日米 PII	Purdue Pharmaと共同開発 経口剤

開発品コード：E2609

薬効／作用機序：アルツハイマー病治療剤／βサイト切断酵素（BACE）阻害剤			自社品
[概要] アミロイド前駆体タンパク質のβサイト切断酵素であるBACEを阻害することで、ペータアミロイドの総量を低下させ、アルツハイマー病の進行を抑制することを期待しています。			
○ 早期アルツハイマー病	301/302試験 (MISSION AD1/2)	日米欧 PIII	Biogen Inc.と共同開発 経口剤

開発品コード：BAN2401

薬効／作用機序：アルツハイマー型認知症治療剤／抗Aβプロトフィブリルモノクローナル抗体			導入品（バイオアーキティック ニューロサイエンス）
[概要] ペータアミロイド（Aβ）プロトフィブリルに対するIgG1抗体です。神経毒性を呈することが報告されているAβプロトフィブリルを除去することで、アルツハイマー型認知症の進行を抑制することを期待しています。			
アルツハイマー型認知症	201試験	日米欧 PII	Biogen Inc.と共同開発 注射剤

○：2016年4月以降の進捗、◎：2017年1月以降の進捗

開発品コード：APD356 一般名：lorcaserin 製品名：Belvia

薬効／作用機序：肥満症治療剤／セロトニン2C受容体作動剤	導入品 (Arena Pharmaceuticals)
<p>[概要] 新規作用機序の肥満症治療剤です。選択的に脳内のセロトニン2C受容体を刺激することにより摂食を抑制し、満腹感を促進すると考えられています。本剤は、米国において、Body Mass Index (BMI) が30kg/m²以上、あるいは少なくとも1つ以上の体重に関連する合併症を有するBMIが27kg/m²以上の成人患者様の体重管理を目的とした食事療法と運動療法に対する補助療法として、2012年6月に米国食品医薬品局 (FDA) より承認され、米国麻薬取締局によるスケジューリング指定を経て、2013年6月に発売されました。2016年7月にメキシコ、2016年12月にブラジルにおいて、それぞれ承認を取得しました。</p>	
○ 肥満症1日1回製剤 (剤形追加)	米国 承認 (2016年7月) 経口剤
肥満症	日本 P I 経口剤

開発品コード：E2027

アルツハイマー型認知症	米国 P I	自社品	経口剤
-------------	--------	-----	-----

開発品コード：E2730

◎ てんかん	米国 P I	自社品	経口剤
--------	--------	-----	-----

○：2016年4月以降の進捗、◎：2017年1月以降の進捗

(2) がん

開発品コード：E7389 一般名：エリブリン 製品名：ハラヴェン

薬効／作用機序：抗がん剤／微小管ダイナミクス阻害剤				自社品
【概要】クロイソカイメン由来のハリコンドリンBの合成類縁体で、微小管の伸長を阻害し細胞周期を停止させることで抗腫瘍活性を示します。米国、欧州、日本、アジアなど、60カ国以上で乳がんに係る承認を取得しています。また、米国、日本、欧州などにおいて悪性軟部腫瘍に係る適応追加の承認を取得しています。				
○ 乳がん	304試験	中国	申請（2016年7月）	注射剤
○ 悪性軟部腫瘍（効能追加）	309試験	欧州	承認（2016年5月・脂肪肉腫）	注射剤
膀胱がん（効能追加）	702試験	米欧	PI/II	注射剤
トリプルネガティブ乳がん （抗PD-1抗体ペムブロリスマブとの併用療法）	218試験	米国	PI/II	Merck & Co., Inc., Kenilworth, N.J., U.S.A.と共同開発 注射剤
○ HER2陰性乳がん（PEGPH20との併用療法）	219試験	米国	PI/II	Halozyneと共同開発 注射剤
リボソーム製剤（剤形追加）	112試験	欧州	PI	注射剤

◎フェーズⅢ段階にあった、非小細胞肺がんを対象とした適応の開発を中止しました。

開発品コード：E7080 一般名：レンバチニブ 製品名：レンビマ/Kisplyx

薬効／作用機序：抗がん剤／分子標的治療薬				自社品
【概要】血管内皮増殖因子受容体(VEGFR)や線維芽細胞増殖因子受容体(FGFR)に加え、血小板由来増殖因子受容体(PDGFR)、KIT、RETなどの腫瘍血管新生あるいは腫瘍悪性化に関与する受容体型チロシンキナーゼ(RTK)に対する選択的阻害活性を有する経口投与可能な、自社創出の新規結合型チロシンキナーゼ阻害剤です。本剤は、VEGFR2とのX線共結晶構造解析から、新たな結合様式(タイプV)を有することが確認された薬剤であり、速度論的解析からは、標的分子に素早く結合し強力なキナーゼ阻害作用を示すことが確認されています。甲状腺がんに係る適応で、米国・日本・欧州、アジアなど50カ国以上で承認を取得しています。また腎細胞がんに係る適応で、米国、欧州などで承認を取得しています。なお、欧州における腎細胞がんに係る適応については、製品名Kisplyxを使用しています。				
◎ 甲状腺がん	308試験	中国	PIII	経口剤
腎細胞がん・セカンドライン（効能追加）	205試験	○ 米国 ○ 欧州 ○ アジア（フィリピン）	承認（2016年5月） 承認（2016年8月） 承認（2016年12月）	経口剤
○ 腎細胞がん・ファーストライン（効能追加）	—	日本	PI	
○ 腎細胞がん・ファーストライン（効能追加）	307試験	米欧	PIII	経口剤
肝細胞がん（効能追加）	304試験	日米欧中ア	PIII	2017年度申請予定 経口剤
非小細胞肺がん（RET転座）（効能追加）	209試験	日米欧ア	PII	経口剤
胆道がん（効能追加）	215試験	日本	PII	経口剤
固形がん（子宮内膜がん、腎細胞がん、頭頸部がん、 尿路上皮がん、非小細胞肺がん、メラノーマ）	111試験	米国	PI/II	Merck & Co., Inc., Kenilworth, N.J., U.S.A.と共同開発 経口剤/注射剤
固形がん（肝細胞がん、子宮内膜がんなど） （抗PD-1抗体ペムブロリスマブとの併用療法）	—	◎ 日本	PI	

*肝細胞がんの申請予定時期を見直し、2016年度から2017年度に変更しました。

◎フェーズⅡ段階にあった子宮内膜がん（単剤療法）、メラノーマおよび非小細胞肺がん（サードライン・単剤療法）を対象とした適応の開発を中止しました。

○：2016年4月以降の進捗、◎：2017年1月以降の進捗

開発品コード：MORAb-003 一般名：ファルレッズマブ

薬効／作用機序：抗がん剤／ヒト化抗葉酸受容体 α モノクローナル抗体			自社品
[概要] 葉酸受容体 α (FRA) に対するヒト化IgG1抗体です。FRAが過剰発現しているがん腫に対して抗腫瘍効果を期待しています。			
プラチナ感受性卵巣がん	O11試験	日米欧 PII	注射剤

◎フェーズII段階にあった、非小細胞肺癌を対象とした適応の開発を中止しました。

開発品コード：MORAb-004

薬効／作用機序：抗がん剤／ヒト化抗エンドシアリンモノクローナル抗体			自社品
[概要] Tumor endothelial marker 1 (TEM-1)/エンドシアリンに対するヒト化IgG1抗体です。エンドシアリンを発現しているがん腫に対して抗腫瘍効果を期待しています。			
メラノーマ	201試験	米欧 PII	注射剤

◎フェーズII段階にあった、大腸がんおよび悪性軟部腫瘍を対象とした適応の開発を中止しました。

開発品コード：MORAb-009 一般名：amatuximab

薬効／作用機序：抗がん剤／キメラ型抗メソセリンモノクローナル抗体			自社品
[概要] メソセリンに対するキメラ型IgG1抗体です。メソセリンを発現しているがん腫に対して抗腫瘍効果を期待しています。			
中皮腫	003/201試験	米欧 PII	注射剤

開発品コード：E7777

薬効／作用機序：抗がん剤／インターロイキン2受容体結合部分とジフテリア毒素の融合タンパク製剤			自社品
[概要] インターロイキン 2 (IL-2) の受容体結合部分とジフテリア毒素の融合タンパク製剤であり、細胞表面上の IL-2 受容体と特異的に結合し、細胞内に移行したジフテリア毒素がタンパク質合成を阻害します。			
末梢性T細胞リンパ腫、皮膚T細胞性リンパ腫	205試験	日本 PII	注射剤

開発品コード：E7090

固形がん	日本 PI	自社品	経口剤
------	-------	-----	-----

開発品コード：MORAb-066

固形がん	米国 PI	導入品 (Janssen Biotech)	注射剤
------	-------	-----------------------	-----

開発品コード：E7046

固形がん	米欧 PI	自社品	経口剤
------	-------	-----	-----

開発品コード：H3B-6527

○ 肝細胞がん	米国 PI	自社品	経口剤
---------	-------	-----	-----

開発品コード：H3B-8800

○ 血液がん	米欧 PI	自社品	経口剤
--------	-------	-----	-----

開発品コード：E7438

○ B細胞性非ホジキンリンパ腫	日本 PI	導入品 (Epizyme, Inc)	経口剤
-----------------	-------	--------------------	-----

◎欧米でフェーズII試験段階にあった、E7820の大腸がんを対象とした適応の開発を中止しました。

○：2016年4月以降の進捗、◎：2017年1月以降の進捗

(3) 消化器

開発品コード：E3810 一般名：ラベプラゾール 製品名：パリエット/アシフェックス

薬効/作用機序：プロトンポンプ阻害剤	自社品
[概要] プロトンポンプ阻害作用に基づき、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、逆流性食道炎、ヘリコバクター・ピロリ除菌、ラベプラゾールを含むヘリコバクター・ピロリ除菌用3剤併用バック製剤などの承認を取得しています。2014年12月に低用量アスピリン投与時における胃潰瘍または十二指腸潰瘍の再発抑制に関する効能・効果および5mg錠の剤形追加の承認を取得しました。	
○ PPI抵抗性逆流性食道炎の維持療法における1回10mgの1日2回投与（用法・用量追加）	311試験 日本 申請（2016年10月） EAファーマと共同開発 経口剤

開発品コード：AJG511 一般名：ブテソニド

薬効/作用機序：潰瘍性大腸炎治療剤/局所作用型ステロイド	導入品（Dr. Falk Pharma）
[概要] 日本初のブテソニドを有効成分とする泡状の注腸製剤（注腸フォーム製剤）です。ブテソニドは局所作用型ステロイドであるため全身性の副作用の低減が期待でき、さらに、泡状であることから直腸およびS状結腸の炎症部位に薬剤が到達し、投与後にも漏れ出しにくい特徴があります。ブテソニド注腸フォーム剤は、欧州においては既に発売されています。	
○ 潰瘍性大腸炎	CT1試験 日本 申請（2016年10月） EAファーマとキッセイ薬品の共同開発 注腸剤

開発品コード：AJG533 一般名：エロビキシバット

薬効/作用機序：慢性便秘症治療剤/胆汁酸トランスポーター阻害剤	導入品（Albireo）
[概要] 新規作用機序をもつ経口便秘薬です。胆汁酸の再吸収に係わる胆汁酸トランスポーターを阻害し、腸管内の胆汁酸を増加させて自然な排便を促します。	
◎ 慢性便秘症	CT1試験 日本 申請（2017年2月） EAファーマと持田製薬の共同開発 経口剤

開発品コード：AJM300 一般名：カロテグラストメチル

薬効/作用機序：潰瘍性大腸炎治療剤/ α 4インテグリン阻害剤	自社品
[概要] α 4インテグリンを阻害することにより、リンパ球の接着・浸潤を防ぐ新規作用機序を有します。経口 α 4インテグリン阻害剤として世界ではじめての製品化をめざしています。	
潰瘍性大腸炎	日本 PIII EAファーマとキッセイ薬品の共同開発 経口剤

開発品コード：AJG555

薬効/作用機序：慢性便秘症治療剤/ポリエチレングリコール製剤	導入品（Norgine）
[概要] ポリエチレングリコール製剤により腸管内の浸透圧制御を行うことで排便を促す経口便秘薬です。	
慢性便秘症	CT1/CT2試験 日本 PIII EAファーマが開発 経口剤

一般名：イソロイシン・ロイシン・バリン顆粒 製品名：リーバクト配合顆粒

薬効/作用機序：分岐鎖アミノ酸製剤	自社品
[概要] 味の素が開発した分岐鎖アミノ酸製剤であり、非代償性肝硬変における血清アルブミン値を改善する薬剤です。日本では「食事摂取量が十分にもかかわらず低アルブミン血症を呈する非代償性肝硬変患者の低アルブミン血症の改善」を効能・効果とし、EAファーマより販売されています。	
低アルブミン血症	中国 PIII 2017年度申請予定 EAファーマと共同開発 経口剤

開発品コード：E6007

薬効/作用機序：潰瘍性大腸炎治療剤/インテグリン活性化阻害剤	自社品
[概要] インテグリン活性化阻害による白血球全般の接着・浸潤を抑制する新規作用機序を有する化合物です。科学技術振興機構の産学共同実用化開発事業として筑波大学と共同で開発を進めています。	
○ 潰瘍性大腸炎	201試験 日本 PII EAファーマが開発 経口剤

開発品コード：E6130

○ 炎症性腸疾患	日本 PI 自社品（EAファーマが開発） 経口剤
----------	--------------------------

○：2016年4月以降の進捗、◎：2017年1月以降の進捗

(4) その他

開発品コード：D2E7 一般名：アダリムマブ 製品名：ヒュミラ

薬効／作用機序：ヒト型抗ヒトTNF α モノクローナル抗体製剤	導入品 (Abbvie)
[概要] 世界で最初のヒト型抗ヒト TNF α モノクローナル抗体であり、自己免疫疾患の炎症反応に関わる中心的なサイトカインである TNF α を中和します。日本では関節リウマチ（関節の構造的損傷の防止を含む）、乾癬、クローン病、強直性脊椎炎、若年性特発性関節炎、腸管性パーチェット病、潰瘍性大腸炎、非感染性ぶどう膜炎の適応を取得しています。	
○ 非感染性ぶどう膜炎（効能追加）	日本 承認（2016年9月） Abbvieと共同開発
	注射剤

開発品コード：E6011

薬効／作用機序：抗フラクタルカイン抗体	自社品
[概要] エーザイグループのカン研究所において創製された、世界初のヒト化抗フラクタルカインモノクローナル抗体です。関節リウマチや炎症性腸疾患をはじめとする炎症性疾患の血管内皮細胞に発現し、炎症反応を惹起するフラクタルカインを中和することによる抗炎症作用を期待しています。	
○ 関節リウマチ	201/202試験 日本 P II 注射剤
○ 原発性胆汁性胆管炎	ET1試験 日本 P II EAファーマが開発 注射剤
クローン病	101試験 日本 P I / II EAファーマが開発 注射剤

開発品コード：MORAb-022

関節リウマチ（抗体）	米国 P I	自社品	注射剤
------------	--------	-----	-----

開発品コード：E6071 (GSK3050002)

自己免疫疾患（抗体）	欧州 P I	自社品（グラクソスミスクラインと共同開発）	注射剤
------------	--------	-----------------------	-----

○：2016年4月以降の進捗、◎：2017年1月以降の進捗