

11. 主要開発品

(1) 神経

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				自社品
薬効／作用機序：抗てんかん剤／AMPA 受容体拮抗剤				経口剤
<p>【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、米国、欧州、中国、アジアなど、70 カ国以上で承認を取得しています。また、日本と米国では、4 歳以上のてんかん患者様の部分発作（二次性全般化発作を含む）に対する単剤療法および併用療法での承認を取得しています。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、アジアなど、70 カ国以上で承認を取得しています。米国、欧州では、経口懸濁液の承認を取得しています。日本では、細粒剤の承認を取得しています。</p>				
	てんかん小児適応（用法用量追加）	311 試験	欧州 中国	◎ 承認（2020年11月） ◎ 申請（2020年10月受理）
◎	部分てんかん単剤療法（効能効果追加）	335 試験	中国	申請（2020年10月受理）
	レノックス・ガスター症候群（効能効果追加）	338 試験	日米欧	PⅢ

開発品コード： ME2125 一般名： サフィナミド 製品名： エクフィナ				導入品 (Meiji Seika ファルマ)
薬効／作用機序：パーキンソン病治療剤／モノアミン酸化酵素 B 阻害剤				経口剤
<p>【概要】 選択的なモノアミン酸化酵素 B (MAO-B) 阻害作用により、分泌されたドーパミンの分解を抑制してドーパミンの脳内濃度維持を助けます。日本では、Meiji Seika ファルマから製造販売承認を承継し、アジアでは独占的開発・販売権を保有しています。</p>				
	パーキンソン病における wearing off 現象の改善	—	韓国	○ 承認（2020年6月）

開発品コード： E2006 一般名： レンボレキサント 製品名： デエビゴ/Dayvigo				自社品
薬効／作用機序：不眠症治療剤／オレキシン受容体拮抗剤				経口剤
<p>【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、速やかな入眠と睡眠維持をもたらすことが期待されます。米国において、入眠困難、睡眠維持困難のいずれかまたはその両方を伴う成人の不眠症の適応で新薬承認を取得しています。日本において、不眠症の適応で新薬承認を取得しています。また、アルツハイマー病／認知症に伴う不規則睡眠覚醒リズム障害で開発中です。</p>				
	アルツハイマー病／認知症に伴う不規則睡眠覚醒リズム障害（効能効果追加）	202 試験	日米	PⅡ

開発品コード： BIIB037 一般名： アデュカヌマブ				共同開発品 (Biogen Inc.)
薬効／作用機序：アルツハイマー病治療剤／抗 Aβ 抗体				注射剤
<p>【概要】 アデュカヌマブは、リバース・トランスレーショナル・メディシン (RTM) と呼ばれる Neurimmune 社のテクノロジー・プラットフォームを用いて作成されたヒト遺伝子組換えモノクローナル抗体 (mAb) であり、認知障害の兆候のない健康な高齢者、または進行が異常に遅い認知機能障害のある高齢者から採取した、非特定化 B 細胞ライブラリーに由来します。Biogen Inc.は、Neurimmune 社よりアデュカヌマブを導入しました。アデュカヌマブは、可溶性オリゴマーと不溶性線維などが凝集してアミロイドプラークを形成しうる形態のアミロイド β (Aβ) を標的とすると考えられています。2020 年 8 月に米国食品医薬品局 (FDA) に BLA (生物製剤ライセンス申請) が受理され、優先審査に指定されました。2020 年 10 月に欧州医薬品庁 (EMA) に販売承認申請が受理され、日本においては、2020 年 12 月に新薬承認申請を行いました。Biogen Inc.と共同開発をしています。</p>				
	アルツハイマー病	ENGAGE/ EMERGE 試験	米国 欧州 日本	○ 申請（2020年8月受理） ◎ 申請（2020年10月受理） ◎ 申請（2020年12月）

開発品コード： BAN2401 一般名： lecanemab				導入品 (BioArctic AB)	
薬効/作用機序：アルツハイマー病疾患修飾剤/抗 Aβ プロトフィブリル抗体				注射剤	
[概要] アミロイドβ (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、アルツハイマー病 (AD) の進行を抑制することを期待しています。Biogen Inc.と共同開発を行っています。AD による軽度認知障害および軽度 AD (総称して早期 AD) を対象としたフェーズⅢ試験 Clarity AD が進行中です。また、Alzheimer's Clinical Trials Consortium (ACTC) と共同でプレクリニカル (無症状期) AD を対象としたフェーズⅢ試験 AHEAD 3-45 を開始し、進行中です。					
	早期 AD	301 試験 (Clarity AD)	日米欧中	PⅢ	
○	プレクリニカル AD	303 試験 (AHEAD 3-45)	日米欧	PⅢ	

開発品コード： E2023 一般名： lorcaserin				導入品 (Arena Pharmaceuticals)	
薬効/作用機序：ドラベ症候群治療剤/セロトニン 2C 受容体作動剤				経口剤	
[概要] 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、GABA 作動性抑制性インターニューロンを活性化し、GABA を介したシナプス抑制を増加させることでドラベ症候群患者様の発作抑制を期待しています。肥満症治療剤適応の承認を取り下げましたが、ドラベ症候群の患者様団体から要請を受けたことから、米国にて延長アクセスプログラムを継続し、さらに、適応症取得をめざすフェーズⅢ試験を開始し、進行中です。FDA からドラベ症候群に関する希少疾病用医薬品 (オーファンドラッグ) の指定を受けています。					
○	ドラベ症候群	304 試験	米国	PⅢ	

開発品コード： E2027				自社品	
薬効/作用機序：レビー小体型認知症治療剤/PDE9 阻害剤				経口剤	
[概要] 選択的なホスホジエステラーゼ (PDE) 9 阻害作用により、細胞内のシグナル伝達に重要なサイクリック GMP (cGMP) の分解を抑制し、cGMP の脳内濃度を維持することにより、レビー小体型認知症に対する新たな治療薬になることを期待しています。					
	レビー小体型認知症	201 試験 (DELPHIA)	日米欧	PⅡ/Ⅲ	

開発品コード： E2730				自社品	
薬効/作用機序：抗てんかん剤・神経疾患治療剤/シナプス機能モジュレーター				経口剤	
[概要] 活性化状態にあるシナプス機能を選択的に調整する新規作用機序を持つ化合物です。希少てんかんを含むてんかんや、てんかん原性等に対する新たな神経疾患治療薬になることを期待しています。					
	てんかん	201 試験	米国	PⅡ	

開発品コード： E2814			共同創出品 (ロンドン大学)		注射剤
	アルツハイマー病	—	米国	PⅠ	

開発品コード： E2511			自社品		経口剤
○	アルツハイマー病	—	米国	PⅠ	

開発品コード： EA4017			自社品		経口剤
○	がん化学療法に伴う末梢神経障害 (EA ファーマが開発)	—	日本	PⅠ	

(2) がん

開発品コード：E7080 一般名：レンパチニブ 製品名：レンピマ				自社品
薬効／作用機序：抗がん剤／キナーゼ阻害剤				経口剤
<p>【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。甲状腺がんに係る適応で、日本、米国、欧州、中国、アジアなど 70 カ国以上で承認を取得しています。また腎細胞がん（セカンドライン）のエベロリムスとの併用療法に係る適応で、米国、欧州など 60 カ国以上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。さらに、肝細胞がん（ファーストライン）に係る適応で、日本、米国、欧州、中国、アジアなど 65 カ国以上において承認を取得しています。ペムプロリズマブとの併用療法について、子宮内膜がんに係る適応で、米国、カナダ、オーストラリアなど 10 カ国以上で承認を取得しています。Merck & Co., Inc., Kenilworth, N.J., U.S.A.（米メルク社）と共同開発をしています。</p>				
単剤療法 米メルク社と共同開発（効能効果追加）				
	甲状腺がん	303/308 試験	中国	◎ 承認（2020 年 11 月）
○	胸腺がん	NCCH1508 試験	日本	申請（2020 年 7 月）
抗 PD-1 抗体ペムプロリズマブとの併用療法 米メルク社と共同開発（効能効果追加）				
	子宮内膜がん・セカンドライン	309 試験	日米欧	◎ 申請準備中
	肝細胞がん・ファーストライン	LEAP-002 試験	日米欧中	PⅢ
	メラノーマ・ファーストライン	LEAP-003 試験	米欧中	PⅢ
	非扁平上皮非小細胞肺がん・ファーストライン	LEAP-006 試験	日米欧中	PⅢ
	PD-L1 陽性の非小細胞肺がん・ファーストライン	LEAP-007 試験	日米欧中	PⅢ
	子宮内膜がん・ファーストライン	LEAP-001 試験	日米欧中	PⅢ
	非小細胞肺がん・セカンドライン	LEAP-008 試験	日米欧	PⅢ
	膀胱がん（シスプラチン不適格）・ファーストライン	LEAP-011 試験	日米欧中	PⅢ
	頭頸部がん・ファーストライン	LEAP-010 試験	日米欧中	PⅢ
◎	胃がん・ファーストライン	LEAP-015 試験	日米欧中	PⅢ
○	頭頸部がん・セカンドライン	LEAP-009 試験	米欧	PⅡ
	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 —	米欧 日本	PⅠ/Ⅱ PⅠ
	メラノーマ・セカンドライン	LEAP-004 試験	米欧	PⅡ
	固形がん（トリプルネガティブ乳がん、卵巣がん、胃がん、大腸がん、膠芽腫、胆道がん、膵臓がん）	LEAP-005 試験	米欧	PⅡ
抗 PD-1 抗体ペムプロリズマブと肝動脈化学塞栓療法との併用療法 米メルク社と共同開発（効能効果追加）				
○	肝細胞がん・ファーストライン	LEAP-012 試験	日米欧中	PⅢ
抗がん剤エベロリムスまたは抗 PD-1 抗体ペムプロリズマブとの併用療法 米メルク社と共同開発（効能効果追加）				
	腎細胞がん・ファーストライン	307 試験	日米欧	◎ 申請準備中
抗 PD-1 抗体ニボルマブとの併用療法 小野薬品と共同開発（効能効果追加）				
	肝細胞がん	—	日本	PⅠ

○2020 年 7 月、116 試験の結果に基づき、米国におけるペムプロリズマブとの併用療法による切除不能肝細胞がんに対する一次療法を適応とした迅速承認申請に関して、FDA より審査完了通知を受領したため本表から削除しました。

開発品コード： E7389 一般名： エリブリン 製品名： ハラヴェン				自社品
薬効／作用機序：抗がん剤／微小管ダイナミクス阻害剤				注射剤
【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。日本、米国、欧州、中国、アジアなど、75 カ国以上で乳がんに係る承認を取得しています。また、日本、米国、欧州、アジアなど、70 カ国以上において脂肪肉腫（日本では悪性軟部腫瘍）に係る適応追加の承認を取得しています。				
単剤療法（剤形追加）				
	リボソーム製剤	—	日欧	PI
抗 PD-1 抗体ニボルマブとの併用療法 小野薬品と共同開発（剤形追加）				
	リボソーム製剤	120 試験	日本	PI / II

○米国でフェーズ I / II 段階にあった HER2 陰性乳がんを対象とした Halozyme 社が開発中の PEGPH20 との併用療法について開発を終了しました。

◎米国でフェーズ I / II 段階にあったトリプルネガティブ乳がんを対象とした抗 PD-1 抗体ベムプロリスマブとの併用療法について開発を終了しました。

開発品コード： E7777 一般名： デニロイキン シフチクス（遺伝子組換え）				自社品
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				注射剤
【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	申請（2020 年 3 月）

開発品コード： E7438 一般名： タゼメトスタット				導入品（Epizyme, Inc.）
薬効／作用機序：抗がん剤／EZH2 阻害剤				経口剤
【概要】 ヒストンメチル基転移酵素を構成するタンパク質の一つである EZH2 は、エピジェネティック関連酵素として、発がんプロセスにおいて重要な役割を担っていると考えられています。E7438 は、Epizyme, Inc. が独自の創薬プラットフォームから創製した、ファーストインクラスの経口投与可能な低分子化合物であり、EZH2 の阻害を介した抗腫瘍効果が期待されています。当社は本剤の日本における開発・商業化権を保有しています。				
	B 細胞性非ホジキンリンパ腫	206 試験	日本	○ 申請（2020 年 6 月）

開発品コード： MORAb-009 一般名： アマツキシマブ				自社品
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				注射剤
【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	PI / II

開発品コード： H3B-6545				自社品
薬効／作用機序：抗がん剤／ER α 阻害剤				経口剤
【概要】 経口投与可能な選択的エストロゲン受容体（ER） α 共有結合型アンタゴニストであり、野生型および変異型 ER α をともに阻害します。ER 陽性／HER2 陰性の乳がんに対する抗腫瘍効果を期待しています。				
	乳がん	101 試験	米欧	PI / II
	乳がん（CDK4/6 阻害剤パルボシクリブとの併用療法）	—	米欧	PI

開発品コード：E7090				自社品	
薬効／作用機序：抗がん剤／FGFR1、2、3 阻害剤				経口剤	
[概要] 経口投与可能な線維芽細胞増殖因子 (FGF) 受容体 (FGFR1、FGFR2、FGFR3) 選択的チロシンキナーゼ阻害剤であり、FGFR2 融合遺伝子を有する切除不能な胆管がん (胆道がんの一種) を対象にフェーズ II 試験を行っています。FGFR2 融合遺伝子を有する切除不能な胆道がんに対する治療を対象に、厚生労働省の「先駆け審査指定制度」の対象品目に指定されています。					
	胆管がん	201 試験	日中		PII
◎	乳がん	—	日本		PI

開発品コード：H3B-6527				自社品		経口剤
	肝細胞がん	—	米欧		PI	

開発品コード：H3B-8800				自社品		経口剤
	血液がん	—	米欧		PI	

開発品コード：E7386				共同創出品 (PRISM BioLab)		経口剤
	固形がん	—	日欧		PI	
	固形がん (レンパチニブとの併用療法)	—	日本		PI	

開発品コード：MORAb-202				自社品		注射剤
	固形がん	—	日本		PI	
○	固形がん	—	米国		PI/II	

開発品コード：E7130				共同創出品 (ハーバード大学)		注射剤
	固形がん	—	日本		PI	

開発品コード：E7766				自社品		液剤
	固形がん	—	米欧		PI	

(3) 消化器

開発品コード： EAM007 製品名： エレビュー		導入品 (Cosmo Technologies)	
薬効／作用機序：粘膜下注入材／医療機器		粘膜下注入材	
[概要] 内視鏡的粘膜切除術および内視鏡的粘膜下層剥離術における食道、胃および大腸腫瘍部位の粘膜隆起を形成・維持し、粘膜層の切除または剥離を容易にします。本品は、EAファーマが製造販売承認を取得した初の医療機器です。EAファーマが開発をしています。			
◎	内視鏡用粘膜下注入材	—	日本 承認 (2020年11月)

開発品コード： AJM300 一般名： カロテグラストメチル		自社品	
薬効／作用機序：潰瘍性大腸炎治療剤／ $\alpha 4$ インテグリン阻害剤		経口剤	
[概要] $\alpha 4$ 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 $\alpha 4$ 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。2021年1月、EAファーマとキッセイ薬品は、日本におけるフェーズⅢ試験において主要評価項目を達成したことを発表しました。EAファーマとキッセイ薬品が共同開発をしています。			
	潰瘍性大腸炎	—	日本 PⅢ

開発品コード： E6007 一般名： milategrast		自社品	
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		経口剤	
[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、EAファーマが筑波大学と共同で製品化をめざしています。EAファーマが開発をしています。			
	潰瘍性大腸炎	201 試験	日本 PⅡ

開発品コード： E6011 一般名： quetmolimab		自社品	
薬効／作用機序：クローン病／ヒト化抗フラクタルカインモノクローナル抗体		注射剤	
[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。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。EAファーマが開発をしています。			
	クローン病	ET2 試験	日欧 PⅡ

開発品コード： EA4000		導入品 (Norgine 社)		経口剤
○	腸管洗浄剤 (EAファーマが開発)	—	日本	PⅠ/Ⅱ

開発品コード： E3112		自社品		注射剤
	肝臓疾患 (EAファーマが開発)	—	日本	PⅠ

開発品コード： AJM347		自社品		経口剤
○	炎症性腸疾患 (EAファーマが開発)	—	欧州	PⅠ

開発品コード： EA1080		自社品		経口剤
○	炎症性腸疾患 (EAファーマが開発)	—	欧州	PⅠ

開発品コード： EA3355		導入品 (Dr. Falk Pharma)		経口剤
○	肝臓疾患 (EAファーマが開発)	—	日本	PⅠ

日：日本、米：米国、欧：欧州、中：中国、P=Phase：臨床試験段階

○：2020年4月以降の進捗、◎：2020年10月以降の進捗

(4) その他

開発品コード：E5564 一般名：エリトラン				自社品	
薬効／作用機序：COVID-19 による重症化抑制／TLR4 拮抗剤				注射剤	
<p>【概要】細菌が持つエンドトキシンの活性本体である Lipid A の化学構造アナログで、天然物有機合成技術を駆使した、TLR (Toll-Like Receptor) 4 拮抗剤です。サイトカインストームの原因となる多種のサイトカイン産生シグナルの最上流に位置する TLR4 の活性化を阻害することで、COVID-19 による炎症や重症化を抑えることが期待されています。GCAR (Global Coalition for Adaptive Research) と共同で開発しています。</p>					
○	COVID-19 による重症化抑制	REMAP-COVID	米国		PⅢ

開発品コード：E6742			自社品		経口剤
	自己免疫疾患	—	日米		PI

開発品コード：E8001			自社品		注射剤
○	臓器移植に伴う拒絶反応	—	日本		PI