

## 14. 主要開発品

### (1) 神経

開発品コード： <b>E2007</b> 一般名： <b>ペランパネル</b> 製品名： <b>フィコンパ/Fycompa</b>				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、米国および中国では、4 歳以上の部分発作（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。欧州では、4 歳以上の部分発作（二次性全般化発作を含む）に対する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。欧州では 7 歳以上、日本と米国では 12 歳以上の全般てんかんの強直間代発作の併用療法での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	中国	○	承認（2021年7月）
部分てんかん単剤療法（効能効果追加）	335 試験	中国	○	承認（2021年7月）
レノックス・ガストー症候群（効能効果追加）	338 試験	日米欧		PⅢ

開発品コード： <b>E2006</b> 一般名： <b>レンボレキサント</b> 製品名： <b>デエビゴ/Dayvigo</b>				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。不眠症に係る適応において、日本、米国、アジアなど 10 カ国以上で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の適応で開発中です。</p>				
○ 不眠症	311 試験	中国		PⅢ
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： <b>BAN2401</b> 一般名： <b>レカネマブ</b>				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
<p>【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。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 も進行中です。2021 年 6 月に米国食品医薬品局（FDA）からブレイクスルーセラピーに指定され、2021 年 9 月に迅速承認制度を活用して、FDA に早期 AD 治療剤としての生物製剤ライセンス申請の段階的申請を開始し、2022 年 5 月に完了しました。2021 年 12 月、FDA からファストトラックに指定されました。2022 年 3 月に日本において早期承認取得をめざし、医薬品事前評価相談制度に基づいて独立行政法人医薬品医療機器総合機構（PMDA）に申請データの提出を開始しました。Biogen Inc.と共同開発を行っています。</p>				
早期 AD	201 試験 301 試験（Clarity AD）	米国 日米欧中	◎	段階的申請完了（2022年5月） 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： <b>E2023</b> 一般名： <b>lorcaserin</b>				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
<p>【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試験が進行中です。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。</p>				
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・パーキンソン病認知症治療剤／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ならびにパーキンソン病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・パーキンソン病認知症	203 試験	米国	PII	

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）		
薬効／作用機序：抗 MTBR タウ抗体		注射剤		
[概要] E2814 は、当社とユニバーシティ・カレッジ・ロンドンとの共同研究を通じて見出された抗微小管結合領域（Microtubule binding region: MTBR）タウ抗体です。タウ伝播種の脳内拡散を抑制することを期待しています。優性遺伝アルツハイマーネットワーク試験ユニット（DIAN-TU）が実施する臨床試験において、抗タウ薬として最初の評価対象薬に選定され、優性遺伝 AD を対象としたフェーズ I b / II 試験とフェーズ II / III 試験 Tau NexGen を開始しました。				
アルツハイマー病	Tau NexGen 試験 103 試験	米国 欧米	◎ ○	PII / III PI / II

開発品コード：E2511		自社品		
薬効／作用機序：シナプス再生剤		経口剤		
[概要] E2511 は、ダメージを受けたコリン作動性神経の回復およびシナプス再形成を促し、神経変性による脳萎縮を抑制することを期待しています。				
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	

◎ アデュカヌマブについて、Biogen Inc.との提携契約を変更したため、本表から削除しました。

## (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 80 カ国以上で承認を取得しています。また、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 75 カ国以上で承認を取得しています。さらに、胸腺がんに係る適応で、日本で承認を取得しています。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。ペムプロリズマブとの併用療法について、子宮内膜がん（全身療法後）に係る適応で、日本（子宮体がん）、米国、欧州、アジアなど 45 カ国以上で承認を取得しています。また、腎細胞がん（ファーストライン）に係る適応で、日本、米国、欧州、アジアなど 35 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。Merck &amp; Co., Inc., Rahway, NJ, USA（米メルク社）と共同開発を行っています。</p>				
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（全身療法後）	309 試験	米国 欧州 日本 アジア（台湾）	○ ○ ○ ◎	承認（2021 年 7 月） 承認（2021 年 11 月） 承認（2021 年 12 月） 承認（2022 年 2 月）
腎細胞がん・ファーストライン	307 試験	米国 欧州 アジア（台湾） 日本	○ ○ ◎ ◎	承認（2021 年 8 月） 承認（2021 年 11 月） 承認（2022 年 1 月） 承認（2022 年 2 月）
子宮内膜がん・ファーストライン	LEAP-001 試験	日米欧中		PⅢ
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
非小細胞肺癌がん（非扁平上皮）（化学療法との併用療法）・ファーストライン	LEAP-006 試験	日米欧中		PⅢ
非小細胞肺癌がん・セカンドライン	LEAP-008 試験	日米欧		PⅢ
頭頸部がん・ファーストライン	LEAP-010 試験	日米欧中		PⅢ
肝細胞がん（肝動脈化学塞栓療法との併用療法）・ファーストライン	LEAP-012 試験	日米欧中		PⅢ
○ 食道がん（化学療法との併用療法）・ファーストライン	LEAP-014 試験	日米欧中		PⅢ
胃がん（化学療法との併用療法）・ファーストライン	LEAP-015 試験	日米欧中		PⅢ
大腸がん（MSI-H を有さない/pMMR）・サードライン	LEAP-017 試験	米欧		PⅢ
メラノーマ・セカンドライン	LEAP-004 試験	米欧		PⅡ
固形がん（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
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、膀胱がん、非小細胞肺癌がん、メラノーマ）	111 試験 —	米欧 日本		PⅠ / Ⅱ PⅠ
抗がん剤エベロリムスとの併用療法 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		PⅢ
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

○ PD-L1 陽性の非小細胞肺癌がん（ファーストライン）を対象とした LEAP-007 試験（フェーズⅢ）について、独立データモニタリング委員会の勧告に従い、中止を決定したため、本表から削除しました。

○ シスプラチン不適格の膀胱がん（ファーストライン）を対象とした LEAP-011 試験（フェーズⅢ）について、独立データモニタリング委員会の勧告に従い、中止を決定したため、本表から削除しました。

日：日本、米：米国、欧：欧州、中：中国、P = Phase：臨床試験段階

◎：2022 年 1 月以降の進捗、○：2021 年 4 月以降の進捗

開発品コード： <b>E7389</b> 一般名： <b>エリブリン</b> 製品名： <b>ハラヴェン</b>				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 80 カ国以上で乳がんに係る適応で承認を取得しています。また、日本、米国、欧州、アジアなど 80 カ国以上で脂肪肉腫（日本では悪性軟部腫瘍）に係る適応で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

開発品コード： <b>E7438</b> 一般名： <b>タゼメトスタット</b> 製品名： <b>タズベリク</b>				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。タズベリクは、Epizyme, Inc.の創薬プラットフォームを活用して創製されたファースト・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	○ 承認（2021 年 6 月）

開発品コード： <b>H3B-6545</b>				自社品
薬効／作用機序：抗がん剤／ER $\alpha$ 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） $\alpha$ 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 $\alpha$ 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： <b>E7090</b>				自社品
薬効／作用機序：抗がん剤／FGFR1、FGFR2、FGFR3 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胆道がんを予定される効能または効果として、厚生労働省よりオーファンドラッグ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： <b>MORAb-202</b>				自社品
薬効／作用機序：抗がん剤／ファルレツズマブ-エリブリン複合体				注射剤
[概要] MORAb-202 は、既に承認されている抗がん剤エリブリンを結合した抗体薬物複合体（ADC）です。腫瘍部位にエリブリンを集中させ、葉酸受容体 $\alpha$ 陽性の子宮内膜がん、卵巣がん、肺がん、乳がんなどへの治療効果を期待しています。2021 年 6 月、Bristol Myers Squibb と共同開発・共同商業化に関するグローバルな独占的戦略的提携契約を締結しました。				
	固形がん	—	米国	PI/II
	固形がん	—	日本	PI

開発品コード：E7386			共同創出品（PRISM BioLab）		経口剤
○	固形がん（ペムプロリズマブとの併用療法）	201 試験	日米		PI / II
	固形がん	—	日欧		PI
	固形がん（レンバチニブとの併用療法）	—	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：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		注射剤
	固形がん	—	米欧		PI

○ MORAb-009 について、米国、欧州でフェーズ I / II 段階にあった中皮腫を対象とした開発を終了したため、本表から削除しました。

○ H3B-8800 について、Roivant Sciences Ltd.の子会社に導出したため、本表から削除しました。

### (3) 消化器

開発品コード：AJM300 一般名：カロテグラストメチル 製品名：カログラ			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。2022 年 3 月、日本において、EA ファーマが経口 $\alpha 4$ インテグリン阻害剤として潰瘍性大腸炎に対する世界で初めての製造販売承認を取得しました。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	◎	承認 (2022 年 3 月)

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：EA3571		自社品		経口剤
◎ 非アルコール性脂肪肝炎 (EA ファーマが開発)	—	日本	PI	

- 腸管洗浄剤 EA4000 について、EA ファーマが事業上の優先度の観点から、日本でフェーズ I / II 段階にあった開発の中止を判断したため、本表から削除しました。
- 肝臓疾患治療薬 EA3355 について、EA ファーマが事業上の優先度の観点から、日本でフェーズ I 段階にあった開発の中止を判断したため、本表から削除しました。
- ◎ 潰瘍性大腸炎治療剤 E6007 について、EA ファーマが事業上の優先度の観点から、日本でフェーズ II 段階にあった開発の中止を判断したため、本表から削除しました。
- ◎ クロウン病治療剤 E6011 について、EA ファーマが事業上の優先度の観点から、日本と欧州でフェーズ II 試験の中止を判断したため、本表から削除しました。

## (4) その他

開発品コード： <b>D2E7</b> 一般名： <b>アダリムマブ</b> 製品名： <b>ヒュミラ</b>	導入品（アッヴィ合同会社）		
薬効／作用機序：ヒト型抗ヒト TNF $\alpha$ モノクローナル抗体	注射剤		
[概要] ヒト型抗ヒト TNF $\alpha$ 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 $\alpha$ 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、腸管型ベーチェット病、潰瘍性大腸炎、非感染性ぶどう膜炎、化膿性汗腺炎、壊疽性膿皮症の適応を取得しています。			
○ 潰瘍性大腸炎（成人高用量・小児）	—	日本	承認（2021年9月）

開発品コード： <b>E5564</b> 一般名： <b>エリトラン</b>	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		
[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、Toll 様受容体（TLR）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。			
COVID-19による重症化抑制	REMAP-COVID	日米	PⅢ

開発品コード： <b>FYU-981</b> 一般名： <b>ドチヌラド</b>	導入品（富士薬品）		
薬効／作用機序：痛風・高尿酸血症治療剤／選択的 URAT1 阻害剤	経口剤		
[概要] 尿酸トランスポーターの1つである URAT1 を選択的に阻害し、腎臓での尿酸の再吸収を妨げ、尿中への尿酸排泄を促進します。その他のトランスポーターなどへの影響が少ないため、より少ない用量で血清尿酸値を低下させ、副作用や薬物相互作用のリスクが低いことが期待されています。日本においては、2020年1月に富士薬品が製造販売承認を取得しています。2020年2月に中国、2021年8月に ASEAN5 カ国における開発・販売に関するライセンス契約を富士薬品と締結しました。			
○ 痛風	301 試験	中国	PⅢ

開発品コード： <b>E6742</b>	自社品		
薬効／作用機序：全身性エリテマトーデス治療剤／TLR7/8 阻害剤	経口剤		
[概要] 自然免疫系の受容体である TLR は、活性化により炎症反応や抗ウイルス応答を引き起こします。E6742 は全身性エリテマトーデス（SLE）の発症機序に関連しているとされる TLR7/8 の経口選択的阻害剤です。国立研究開発法人日本医療研究開発機構（AMED）の医療研究開発革新基盤創成事業（CICLE）に採択されています。			
◎ 全身性エリテマトーデス	101 試験	日本	PⅠ/Ⅱ

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