

# 主要研究開発パイプライン

2017年5月現在



領域	フェーズ 1	フェーズ 2	フェーズ 3	承認申請
がん	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ DS-3032 (米日) (MDM2阻害剤)</li> <li>■ PLX7486 (米) (FMS/TRK阻害剤)</li> <li>■ PLX8394 (米) (BRAF阻害剤)</li> <li>■ DS-6051 (米日) (NTRK/ROS1阻害剤)</li> <li>■ PLX9486 (米) (KIT阻害剤)</li> <li>■ DS-3201 (日米) (EZH1/2阻害剤)</li> <li>■ PLX73086 (米) (CSF-1R阻害剤)</li> <li>■ PLX51107 (米) (BRD4阻害剤)</li> <li>■ DS-8273 (米) (抗DR5抗体)</li> <li>■ DS-8201 (日米) (抗HER2 ADC)</li> <li>■ DS-1123 (日) (抗FGFR2抗体)</li> <li>■ U3-1402 (日) (抗HER3 ADC)</li> <li>■ <b>DS-1001 (日)</b> (変異型IDH1阻害剤)</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ パトリツマブ (欧) (U3-1287/頭頸部がん/抗HER3抗体)</li> <li>■ ペキシダルチニブ (米) (PLX3397/膠芽細胞腫/CSF-1R/KIT/FLT3-ITD阻害剤)</li> <li>■ DS-1647 (日) (膠芽腫 / G47Δウイルス)</li> <li>■ <b>キザルチニブ (日)</b> (AC220/急性骨髄性白血病-2nd/FLT3-ITD阻害剤)</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ デノスマブ (日) (AMG 162/乳がん補助療法/抗RANKL抗体)</li> <li>■ ニモツズマブ (日) (DE-766/胃がん/抗EGFR抗体)</li> <li>■ ベムラフェニブ (米欧) (PLX4032/メタスタシス補助療法/BRAF阻害剤)</li> <li>■ キザルチニブ (米欧亜) (AC220/急性骨髄性白血病-2nd/FLT3-ITD阻害剤)</li> <li>■ キザルチニブ (米欧亜) (AC220/急性骨髄性白血病-1st/FLT3-ITD阻害剤)</li> <li>■ ペキシダルチニブ (米欧) (PLX3397/腫瘍巨細胞腫/CSF-1R/KIT/FLT3-ITD阻害剤)</li> </ul>	
循環代謝	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ DS-1040 (急性期虚血性脳血管障害/TAFIa阻害剤)</li> <li>■ DS-2330 (高リン酸血症)</li> <li>■ DS-9231/TS23 (血栓症/抗α2-PI抗体)</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ エサキセロン(日) (CS-3150/糖尿病性腎症/MR拮抗薬)</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ エドキサバン(日) (DU-176b/AF/経口FXa阻害剤)</li> <li>■ プラスグレル(日) (CS-747/虚血性脳血管障害/抗血小板剤)</li> <li>■ エサキセロン(日) (CS-3150/高血圧症/MR拮抗薬)</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ エドキサバン (ASCA 他) (DU-176b/AF/経口FXa阻害剤)</li> <li>■ エドキサバン (ASCA 他) (DU-176b/VTE/経口FXa阻害剤)</li> </ul>
その他	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ DS-1971 (慢性疼痛)</li> <li>■ DS-1501 (米) (骨粗鬆症/抗Siglec-15抗体)</li> <li>■ DS-7080 (米) (加齢黄斑変性症/血管新生抑制剤)</li> <li>■ DS-2969 (米) (クロストリジウム・デフィシル感染症/GyrB 阻害剤)</li> <li>■ DS-5141 (日) (DMD/ENAオリゴヌクレオチド)</li> <li>■ VN-0102/JVC-001 (日) (MMRワクチン)</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ ラニナミビル (米欧) (CS-8958/抗インフルエンザ/ピオタと導出活動中)</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ ミロガバリン (米欧) (DS-5565/線維筋痛症/α2δリガンド)</li> <li>■ ミロガバリン (日亜) (DS-5565/DPNP/α2δリガンド)</li> <li>■ ミロガバリン (日亜) (DS-5565/PHN/α2δリガンド)</li> <li>■ CHS-0214 (日) (エタネルセプトバイオ後続/関節リウマチ/TNFα阻害剤)</li> <li>■ VN-0105 (日) (DPT-IPV/Hib /5種混合ワクチン)</li> <li>■ ラニナミビル (日) (CS-8958/抗インフルエンザ/ネブライザー)</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>■ <b>ヒドロモルフォン (日)</b> (DS-7113/がん性疼痛/μオピオイド受容体作動薬)&lt;注射剤&gt;</li> <li>■ CL-108 (米) (急性疼痛/μオピオイド受容体作動薬)</li> <li>■ 皮内用インフルエンザHAワクチン(日) (VN-100 / インフルエンザ感染症)</li> <li>■ VN-0107/MEDI3250 (日) (鼻腔噴霧4価インフルエンザワクチン)</li> <li>■ デノスマブ (日) (AMG 162/関節リウマチ/抗RANKL抗体)</li> </ul>

赤字: 2016年度第3四半期決算発表(2017年1月31日)以降の主な変更点

## 12. 主要開発品目(イノベティブ医薬品)

## ◆ がん(後期開発品目)

一般名 / 開発コード	薬効/作用機序	目標適応	地域	ステージ	剤形	パートナー	承認・上市 予定年度	備考
デノスマブ(遺伝子組換え)/ AMG 162	抗RANKL抗体	乳がん術後補助療法	日	P3	注射	アムジェン	2020	効能追加
製品名:ランマーク(日)	ヒトモノクローナル抗体で、RANKリガンド(RANKL: 破骨細胞の形成、機能及び生存に必須の蛋白質)を標的とするファーストインクラスの抗体製剤。							
ベムラフェニブ / PLX4032	BRAF阻害剤	メラノーマ術後補助療法	米欧	P3	経口	-	-	効能追加 導出先Rocheが試験を実施、2017年申請予定
製品名:ゼルボラフ	BRAF遺伝子に変異があるがんをターゲットとした分子標的薬。							
キザルチニブ(quizartinib)/ AC220	FLT3-ITD阻害剤	急性骨髄性白血病	米欧亜	P3	経口	-	2018	再発性/治療抵抗性患者を対象
			米欧亜	P3			2021以降	新規に診断された患者を対象
			日	P2			2018以降	再発性/治療抵抗性患者を対象
受容体型チロシンキナーゼであるFLT3に対するキナーゼ阻害剤。FLT3-ITD変異が生じることによってがん化した急性骨髄性白血病に対して治療効果を示すことが期待される。								
ペキシダルチニブ(pexidartinib)/ PLX3397	CSF-1R/KIT/ FLT3-ITD阻害剤	腱滑膜巨細胞腫	米欧	P3	経口	-	2019	色素性絨毛結節性滑膜炎を含む
		固形がん	亜	P1			-	腱滑膜巨細胞腫を含む
		膠芽細胞腫	米	P2			-	
		c-KIT メラノーマ	亜	P1/2			-	
		メラノーマ、固形がん	米	P1/2			-	Merck & Co., Inc.
CSF-1R、KIT及びFLT3-ITDを特異的に阻害する分子標的薬。がん細胞の増殖阻害、転移拡大抑制効果等が期待される。								
ニモツズマブ(nimotuzumab)/ DE-766	抗EGFR抗体	胃がん	日	P3	注射	InnoCIMA B Pte Ltd	2020	
細胞の成長因子(上皮細胞成長因子)の受容体の一つであるEGFRを特異的に結合するヒトモノクローナル抗体。がん細胞の細胞分裂等を抑制。他のEGFR抗体と比べて、皮疹が少ない安全性プロファイルを示すことが期待される。								
パトリツマブ(patritumab)/ U3-1287	抗HER3抗体	頭頸部がん	欧	P2	注射	-	-	
細胞の成長因子(上皮細胞成長因子)のファミリー受容体の一つであるHER3と特異的に結合する完全ヒト型モノクローナル抗体。HER3のヘテロダイマーの相手となるHER2あるいはEGFRからのシグナル伝達を抑制することにより、がん細胞の細胞分裂等を抑制することが期待される。								
DS-1647(G47Δ)	がん治療用HSV-1	膠芽腫	日	P2	注射	アクティベック創薬	-	先駆け審査指定品目、医師主導試験を実施中
単純ヘルペスウイルス1型(HSV-1)を、遺伝子組換え技術により、がん細胞だけで増殖するように改変した第三世代のがん治療用HSV-1。既存のがん治療用HSV-1に比べ、より高い抗がん活性と同等以上の安全性が期待される。								

下線: 2017年1月(2016年度Q3決算発表)以降の主な変更点

◆ がん(初期開発品目)

一般名 / 開発コード	薬効/作用機序	目標適応	地域	ステージ	パートナー	承認・上市 予定年度	備考
DS-3032	MDM2阻害剤	固形がん	米日	P1	-	-	
		血液がん	米	P1			
PLX7486	FMS/TRK阻害剤	固形がん	米	P1	-	-	
DS-8273	抗DR5抗体	固形がん	米	P1	-	-	
PLX8394	BRAF阻害剤	固形がん	米	P1	-	-	
		白血病	米	P1			
DS-6051	NTRK/ROS1阻害剤	固形がん	米日	P1	-	-	
PLX9486	KIT阻害剤	固形がん	米	P1	-	-	
DS-8201	抗HER2抗体薬物複合体	固形がん	日米	P1	-	-	米国FDAよりHER2陽性の転移性乳がん治療を対象にファストトラック(優先承認審査)指定
DS-1123	抗FGFR2抗体	固形がん	日	P1	-	-	
DS-3201	EZH1/2阻害剤	非ホジキンリンパ腫	日	P1	-	-	
		急性骨髄性白血病	米	P1			
PLX73086 / AC708	CSF-1R阻害剤	腱滑膜巨細胞腫	米	P1	-	-	
PLX51107	BRD4阻害剤	血液がん	米	P1	-	-	
U3-1402	抗HER3抗体薬物複合体	固形がん	日	P1	-	-	
DS-1001	変異型IDH1阻害剤	神経膠腫/グリオーマ	日	P1	-	-	

下線:2017年1月(2016年度Q3決算発表)以降の主な変更点

◆ 循環代謝 (後期開発品目)

一般名 / 開発コード	薬効/作用機序	目標適応	地域	ステージ	剤形	パートナー	承認・上市 予定年度	備考
エドキサバントシル酸塩 水和物 / DU-176b  製品名: リクシアナ(日、欧、亜) サベイサ(米)	FXa阻害剤	心房細動に伴う虚血性脳卒中及び全身性塞 栓症の発症抑制(AF)	ASCA他	申請中			-	ブラジル(14/6*)、中国(15/8)申請 * 2014年6月を意味する。以下同様
		静脈血栓塞栓症(VTE)	ASCA他	申請中	経口	-	-	ブラジル(14/6)、中国(15/8)申請
		高齢非弁膜症性心房細動患者における 脳卒中及び全身性塞栓症の発症抑制(AF)	日	P3			2021	高齢(80歳以上)AF患者における新規用法・用量の追加
1日1回投与の経口FXa阻害剤(抗凝固剤)。血管内で血液凝固に関与するFXa(活性化血液凝固第X因子)を選択的、可逆的かつ直接的に阻害する。								
プラスグレル塩塩 / CS-747	抗血小板剤	虚血性脳血管障害	日	P3	経口	宇部興産	2018	効能追加、フェーズ3試験終了
製品名:エフィエント(日、米、欧、亜) 経口抗血小板剤。血小板の凝集を抑制することにより、動脈の狭窄・閉塞を抑制する。								
エサキセレン(esarerenone)/ CS-3150	MR拮抗薬	高血圧症	日	P3	経口	Exelixis, Inc.	2019	
		糖尿病性腎症	日	P2b			-	
腎臓でのナトリウム再吸収を促進するアルドステロンの受容体(MR)に作用し、アルドステロンの結合を阻害することで降圧作用及び臓器保護作用を示すことが期待される。								

下線: 2017年1月(2016年度Q3決算発表)以降の主な変更点

◆ 循環代謝 (初期開発品目)

一般名 / 開発コード	薬効/作用機序	目標適応	地域	ステージ	パートナー	承認・上市 予定年度	備考
DS-1040	TAFIa阻害剤	急性期虚血性脳血管障害、 急性肺血栓塞栓症	-	P1	-	-	
DS-2330	高リン酸血症治療剤	高リン酸血症(慢性腎不全による)	-	P1	-	-	
DS-9231 / TS23	抗 $\alpha$ 2-PI 抗体	血栓症(心血管疾患、虚血性脳梗塞)	-	P1	Translational Sciences, Inc.	-	Translational Sciences, Inc. から導入

下線: 2017年1月(2016年度Q3決算発表)以降の主な変更点

◆ その他（後期開発品目）

一般名 / 開発コード	薬効/作用機序	目標適応	地域	ステージ	剤形	パートナー	承認・上市 予定年度	備考
CL-108	制吐剤配合 μオピオイド受容体作動薬	急性疼痛	米	CRL受領	経口	Charleston Laboratories, Inc.	-	米国FDAから2017年1月末日付けの 審査完了報告通知(CRL)受領
ヒドロコドン、アセトアミノフェン、プロメタジン成分とする制吐剤配合麻薬性鎮痛剤。オピオイドによる代表的副作用として知られている悪心・嘔吐による患者さんの負担を軽減した疼痛治療への貢献が期待される。								
ヒドロモルフォン / DS-7113	μオピオイド受容体作動薬	がん性疼痛	日	承認	経口	-	-	第一三共プロファーマが2017年3月に承認取得 徐放及び即放性製剤
製品名: ナルラビド(日):即放性製剤 ナルサス(日):徐放性製剤			日	申請中	注射		2017	第一三共プロファーマが2017年2月に申請 剤形追加
麻薬性鎮痛剤。								
ミロガバリンベシル酸塩 / DS-5565	α2δリガンド	線維筋痛症	米欧	P3	経口	-	2019	神経終末において疼痛にかかわる神経伝達物質の放出を抑制。有効性、安全性のバランスにおいて優れたプロファイルが期待される。
		糖尿病性末梢神経障害性疼痛	日垂	P3			2018	
		帯状疱疹後神経痛	日垂	P3			2018	
デノスマブ(遺伝子組換え)/ AMG 162	抗RANKL抗体	関節リウマチ	日	申請中	注射	アムジェン	2017	2016年9月 効能追加 申請
製品名:ブラリア(日)	ヒトモノクローナル抗体で、RANKリガンド(RANKL:破骨細胞の形成、機能及び生存に必須の蛋白質)を標的とするファーストインクラスの抗体製剤。							
CHS-0214	TNFα阻害剤	関節リウマチ	日	P3	注射	Coherus BioSciences, Inc.	2018	申請準備中
エタネルセプトのバイオ後続品。								
ラニナミビルオクタン酸エステル 水和物 / CS-8958	ノイラミニダーゼ阻害剤	インフルエンザ	米欧	P2	吸入	-	-	ビオタと導出活動中
			日	P3			-	剤形追加、ネブライザー用製剤
製品名:イナビル(日)	長時間作用型ノイラミニダーゼ阻害剤。インフルエンザウイルスの感染部位である肺、気管に直接作用する吸入剤。							

下線: 2017年1月(2016年度Q3決算発表)以降の主な変更点

◆ その他（初期開発品目）

一般名 / 開発コード	薬効/作用機序	目標適応	地域	ステージ	剤形	パートナー	承認・上市 予定年度	備考
DS-1971	鎮痛剤	慢性疼痛	-	P1	-	-	-	
DS-1501	抗Siglec-15抗体	骨粗鬆症	米	P1	-	-	-	
DS-7080	血管新生抑制剤	加齢黄斑変性症	米	P1	-	-	-	
DS-2969	GyrB 阻害剤	クロストリジウム・デフィシル感染症	米	P1	-	-	-	導出活動中
DS-5141	ENAオリゴヌクレオチド	デュシェンヌ型筋ジストロフィー症	日	P1/2	-	-	-	厚生労働省より2017年4月に先駆け審査品目に指定

下線: 2017年1月(2016年度Q3決算発表)以降の主な変更点

◆ ワクチン

一般名 / 開発コード	薬効/作用機序	目標適応	地域	ステージ	剤形	パートナー	承認・上市 予定年度	備考
皮内用インフルエンザHAワクチン / VN-100	皮内投与型季節性インフルエンザワクチン	季節性インフルエンザの予防	日	申請中	注射*	テルモ	-	ジャパンワクチンが2015年4月に申請 注射*:プレフィルドシリンジ
								第一三共、テルモ、ジャパンワクチン、北里第一三共ワクチンが共同で開発したプレフィルドシリンジ型の皮内用インフルエンザHAワクチン。本ワクチンの皮内投与デバイスは、従来困難だった皮内注射を簡便かつ確実に実施できることをコンセプトにテルモが開発したもので、皮下組織の末梢血管及び神経に対するリスクを低減できるよう工夫しており、針に対する抵抗感など負担軽減も期待される。
VN-0107 / MEDI3250	鼻腔噴霧インフルエンザ弱毒生ワクチン	季節性インフルエンザの予防	日	申請中	経鼻	AstraZeneca/ MedImmune	-	第一三共が2016年6月に申請
								本ワクチン(米国における製品名:FluMist Quadrivalent)は、季節性インフルエンザの予防に使用される、4種類のインフルエンザウイルスを含む、鼻腔噴霧型のインフルエンザ弱毒生ワクチン。
VN-0105	DPT-IPV/Hibワクチン	百日せき、ジフテリア、破傷風、急性灰白髄炎及びHib感染予防	日	P3	注射	サノフィバツツール	2019	サノフィ、北里第一三共ワクチンとの共同開発
								すでに日本国内で上市している沈降精製百日せきジフテリア破傷風不活性化ポリオ(ソークワクチン)混合ワクチンとヒブワクチンを混合して使用する国内初の5種混合ワクチン(DPT-IPV/Hib)。
VN-0102 / JVC-001	麻しんおたふくかぜ風しん混合ワクチン	麻しん、おたふくかぜ及び風しんの予防	日	P1/2	注射	-	-	ジャパンワクチンがフェーズ1/2試験実施中

下線:2017年1月(2016年度Q3決算発表)以降の主な変更点

◆ ステージアップ品目 (2017年1月(2016年度Q3決算発表)以降の主な変更点)

一般名 / 開発コード	薬効/作用機序	目標適応	変更後地域・ステージ	備考
キザルチニブ(quizartinib)/AC220	FLT3-ITD阻害剤	急性骨髄性白血病	日 P2	フェーズ2試験を開始
DS-3201	EZH1/2阻害剤	急性骨髄性白血病	米 P1	フェーズ1試験を開始
DS-1001	変異型IDH1阻害剤	神経膠腫/グリオーマ	日 P1	フェーズ1試験を開始
ヒドロモルフォン / DS-7113	μオピオイド受容体作動薬	がん性疼痛	日 承認	第一三共プロファーマが2017年3月に承認取得 徐放及び即放性製剤
			日 申請中	第一三共プロファーマが2017年2月に申請 剤形追加

◆ 開発中止品目 (2017年1月(2016年度Q3決算発表)以降の主な変更点)

一般名 / 開発コード	薬効/作用機序	適応症・目標適応	中止時開発ステージ	中止理由
チバンチニブ / ARQ 197	MET阻害剤	肝細胞がん	米欧 P3	所期の目的を達成しなかった為中止を決定
DS-8895	抗EPHA2抗体	固形がん	日 P1	ポートフォリオ上の理由により中止を決定
DS-5573	抗B7-H3抗体	固形がん	日 P1	ポートフォリオ上の理由により中止を決定
U3-1784	抗FGFR4抗体	固形がん	欧 P1	ポートフォリオ上の理由により中止を決定
DS-8500	GPR119作動薬	糖尿病	日米 P2	所期の目的を達成しなかった為中止を決定
DS-9001	抗PCSK9アンチカリン- アルブモッド	脂質異常症	- P1	所期の目的を達成しなかった為中止を決定