



## Press Release

2019年9月10日

報道関係者各位

会 社 名 第一三共株式会社  
代 表 者 代表取締役社長 眞鍋 淳  
(コード番号 4568 東証第1部)  
問 合 せ 先 コーポレートコミュニケーション部長 大沼 純一  
TEL 03-6225-1126

### 世界肺がん学会議（WCLC）で発表する 非小細胞肺がんにおける U3-1402 の第1相臨床試験の最新データについて

第一三共株式会社（本社：東京都中央区、以下「当社」）は、EGFR チロシンキナーゼ阻害剤の投与中に病勢進行した EGFR 変異のある転移性非小細胞肺がん患者を対象とした U3-1402（HER3 に対する抗体薬物複合体（ADC）\*1、以下「本剤」）の第1相臨床試験（以下「本試験」）の用量漸増パートにおける安全性と有効性に関する最新データについて、スペインのバルセロナで開催中の世界肺がん学会議（WCLC 2019）において発表しますので、その概要についてお知らせいたします。

安全性については、非小細胞肺がん患者 30 名において、グレード 3\*2 以上の主な有害事象（発現率>10%）として、血小板数減少（20.0%）がみられ、用量制限毒性としてグレード 4\*2 の血小板数減少（4 名）、グレード 3 の発熱性好中球数減少（1 名）がみられました。また、同試験における用量展開パートの推奨用量は 5.6mg/kg に決定されました。

予備的有効性については、評価可能な非小細胞肺がん患者 26 名中 22 名に腫瘍の縮小がみられ、腫瘍サイズの最大変化率の中央値は -25.7%（13.3% ~ -82.6%）でした。腫瘍の縮小がみられた 22 名のうち 6 名は部分奏効\*3 と判定されました。なお、30 名中 28 名はオシメルチニブ、30 名中 15 名は化学療法による前治療歴があります。

今後、本試験は、EGFR 変異の有無に関わらず転移性非小細胞肺がんにおける本剤の有効性を評価するため用量展開パートに移行し、当社は本剤の開発を更に推進してまいります。当社は、様々な標的やがん種への当社ADC技術の応用可能性を期待しており、今後、本剤を含むADCフランチャイズの開発を加速してまいります。

以 上

- \*1 抗体薬物複合体（ADC）とは、抗体と薬物（低分子化合物）を適切なリンカーを介して結合させた薬剤で、がん細胞に発現している標的因子に結合する抗体を介して薬物をがん細胞へ直接届けることで、薬物の全身曝露を抑えつつがん細胞への攻撃力を高めています。
- \*2 米国国立がん研究所（NCI）の有害事象共通用語規準（CTCAE）で規定された重症度を意味し、グレード1～5に分類されます。
- \*3 部分奏効とは、腫瘍が30%以上減少した状態です。確定した部分奏効を意味します。

### U3-1402 について

U3-1402 は、トラスツズマブ デルクステカン（DS-8201）に続いて、当社で2番目に臨床開発段階に入った抗体薬物複合体（ADC）で、当社独自のADC技術を用いて創製されました。当社独自のリンカーを介して新規のトポイソメラーゼI阻害剤（以下「DXd」）を抗HER3抗体に結合させた薬剤で、1つの抗体につき約8個のDXdが結合しています。薬物をがん細胞内に直接届けることで、薬物の全身曝露を抑えるよう設計されています。

### 非小細胞肺癌について

肺癌は、世界中で多く見られるがんであり、がんの主要な死亡原因となっています。2018年の調査において、新規患者は世界で210万人／年、死亡数は180万人／年と推定されています。肺癌のうち80～85%は非小細胞肺癌で、分子標的薬や免疫チェックポイント阻害剤が登場し、進行性・転移性の非小細胞肺癌の治療は改善していますが、既存治療が適応できない患者やがんの進行が見られる患者において、新たな治療法が必要とされています。

HER3は、異常な細胞増殖と関連する受容体であるHERファミリーのひとつであり、非小細胞肺癌の75%に発現しており、非小細胞肺癌患者のがん転移や生存率の低下に関係していると言われています。現在、非小細胞肺癌を含むがん患者を対象に承認されているHER3を標的とした治療法はありません。

### 第一三共のがん事業について

当社のがん事業は、世界最先端のサイエンス（科学的知見、技術）を応用し、がん患者さんのための革新的な治療を提供することを使命としています。

当社は、日本のがん領域ラボラトリー（バイオ・がん免疫・低分子）と米国プレキシコン（低分子）の強力な研究体制を通じて、がん領域の開発パイプラインの拡充を進めており、抗体薬物複合体（ADC）フランチャイズ、急性骨髄性白血病（AML）フランチャイズおよびブレイクスルー・サイエンスを3つの柱として、2018年から2025年までの8年間に7つの革新的新薬の上市を目指します。