

# 開発中新薬のアップデート

2006年5月16日

アステラス製薬株式会社  
常務執行役員 開発本部長 清水政男



# プロジェクトの着実な進展

プログラフ(関節リウマチ)	2005年 4月	承認取得(日本)
FK506(ループス腎炎)	2005年10月	承認申請(日本)
FK506(徐放性製剤)	2005年12月	承認申請(米国)
	2006年 1月	承認申請(欧州)
バプリゾール(低ナトリウム血症)	2005年12月	承認取得(米国)
YM060(過敏性腸症候群)	2006年 1月	承認申請(日本)
YM026(ヒクアナイト系製剤併用)	2006年 1月	承認申請(日本)
FK463(予防投与)	2006年 1月	承認申請(日本)
プログラフ(心移植)	2006年 3月	承認取得(米国)
RSD1235(心房細動)	2006年 3月	承認申請(米国)
FK463(深在性真菌症)	2006年 4月	承認申請(欧州)
ファンガード(小児適応)	2006年 4月	承認取得(日本)
ベシケア(過活動膀胱)	2006年 4月	承認取得(日本)

# 日本 承認取得

製品名 (開発コード)	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
ベシケア (YM905)	過活動膀胱に伴う尿意切迫感、 頻尿、切迫性尿失禁	Mスカン受容体拮抗剤	経口
ファンガード (FK463)	深在性真菌症(小児)	抗真菌剤	注射

# 日本 申請中/申請準備中



## 【申請中】

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
YM177	関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症等	COX-II阻害剤	経口
YM152	前立腺肥大	5-還元酵素阻害剤	経口
FK506	ループス腎炎	免疫抑制剤	経口
YM060	過敏性腸症候群 (IBS)	5-HT <sub>3</sub> 受容体拮抗剤	経口
YM026	2型糖尿病 ヒグアナイド系製剤との併用	速効・短時間型 インスリン分泌促進剤	経口
FK463	造血幹細胞移植患者におけるアスペルギルス症及びカンジダ症の予防	抗真菌剤	注射

## 【申請準備中】

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
T-3811	呼吸器感染症、耳鼻科感染症	合成抗菌剤	経口
<b>FK506</b>	<b>臓器移植における拒絶反応 (徐放性製剤)</b>	<b>免疫抑制剤</b>	<b>経口<sub>4</sub></b>

# 日本 フェーズ

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
YM529	骨粗鬆症	骨吸収抑制剤	経口
YM617	下部尿路症	$\alpha_1$ 受容体拮抗剤	経口
YM643	C型慢性肝炎 リバビリン併用	コンセンサス インターフェロン製剤	注射/ 経口併用
YM086	糖尿病性腎症	アンジオテンシン 受容体拮抗剤	経口
YM026	2型糖尿病 インスリン抵抗性改善薬との併用	速効・短時間型 インスリン分泌促進剤	経口
YM177	術後・外傷後および抜歯後疼痛	COX-II阻害剤	経口
FK506	潰瘍性大腸炎	免疫抑制剤	経口
テリスロマイシン	感染症(小児)	ケトライト系経口抗菌剤	経口
YM1170	症候性胃食道逆流症(S-GERD)	H <sub>2</sub> 受容体拮抗剤	経口
FK506	(全ての)重症筋無力症	免疫抑制剤	経口
FK199B	不眠症(徐放性製剤)	1受容体作動薬	経口

# 日本 フェーズ

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
YM974	関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症等	COX-II阻害剤	経口
YM978	急性疼痛	COX-II阻害剤	注射
FK481	骨粗鬆症	骨形成促進・吸収阻害剤	経口
YM533	慢性腎不全(原発性・腎硬化)	プロスタサイクリン受容体刺激剤	経口

# 米国 申請中/フェーズ



## 【申請中】

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
YM087(*)	体液貯留型の低ナトリウム血症	バソプレシン受容体拮抗剤	注射
FK506	臓器移植における拒絶反応 (徐放性製剤)	免疫抑制剤	経口
<b>RSD1235</b>	<b>心房細動</b>	<b>抗不整脈剤</b>	<b>注射</b>

\* YM087:2005年12月に米国食品医薬品局 (FDA) より承認可能通知を受領

## 【フェーズ】

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
FK506	アトピー性皮膚炎	免疫抑制剤	クリーム
CVT-3146	画像診断時の薬理的負荷 (心機能検査補助剤)	アデノシンA2a作動薬	注射
FK506	乾癬	免疫抑制剤	クリーム
テラバンシン	グラム陽性菌に起因する複雑性皮膚・軟部組織感染症、院内肺炎	脂質化グリコペプチド系 抗生物質	注射
YM617	神経因性の排尿障害(小児)	受容体拮抗剤	経口

# 米国 フェーズ

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
YM443	機能的胃腸症	アセチルコリン遊離促進剤	経口
FK778	肝・腎移植における拒絶反応	免疫抑制剤	経口
カルペリド <sup>*</sup>	急性心不全	型ヒト心房性 ナトリウム利尿ペプチド <sup>*</sup>	注射
FK962	アルツハイマー型痴呆症	抗痴呆剤	経口
YM155	ホルモン抵抗性前立腺癌、 非小細胞肺癌、メラノーマ他	Survivin発現抑制剤	注射
FK506	喘息	免疫抑制剤	吸入
YM672	間質性膀胱炎	抗アレルギー剤	経口

# 欧州 申請中/フェーズ

## 【申請中】

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
FK506	臓器移植における拒絶反応 (徐放性製剤)	免疫抑制剤	経口
FK463	深在性真菌症	抗真菌剤	注射

## 【フェーズ】

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
テラバンシン	グラム陽性菌に起因する複雑性皮膚・軟部組織感染症、院内肺炎	脂質化グリコペプチド系 抗生物質	注射

# 欧州 フェーズ

開発コード	対象疾患	薬効/作用機序	剤形
YM178	過活動膀胱に伴う頻尿、 尿意切迫感、尿失禁	3受容体作働薬	経口
YM150	術後静脈血栓塞栓症予防、 心房細動の血栓症予防	ファクターXa阻害剤	経口
YM060	過敏性腸症候群 (IBS)	5-HT <sub>3</sub> 受容体拮抗剤	経口
YM617	前立腺肥大症の排尿障害	1受容体拮抗剤	口腔内 崩壊錠
FK778	肝・腎移植における拒絶反応	免疫抑制剤	経口
FK506	喘息	免疫抑制剤	吸入
YM155	ホルモン抵抗性前立腺癌、 非小細胞肺癌、メラノーマ他	Survivin発現抑制剤	注射
YM672	間質性膀胱炎	抗アレルギー剤	経口
<b>FG-2216/ YM311</b>	<b>腎性貧血、癌化学療法に伴う貧血</b>	<b>HIF安定化剤</b>	<b>経口</b>

# 開発初期のプロジェクト数/開発中止プロジェクト

## 【開発初期(フェーズ・前臨床)のプロジェクト数】

**総数: 28** [泌尿器: 6、炎症・免疫(移植): 6、感染症: 2、糖尿病: 4、  
消化器: 1、中枢: 5、運動器: 1、その他: 3]

## 【開発中止プロジェクト】

開発コード	開発ステージ	対象疾患	理由
FK949	(日本)フェーズ	認知症における精神症状及び行動障害	認知症における精神症状及び行動障害について、日本人を対象とした国内フェーズ試験において有効性を検討した結果、開発を中止することとした。
FK506	(米国) フェーズ (欧州) フェーズ	関節リウマチ	効果は認められたが、製品のポジショニング、競合状況等を総合的に評価し、中止を決定。

■申請適応症：心房細動

■申請日： 2006年3月30日

■特長：

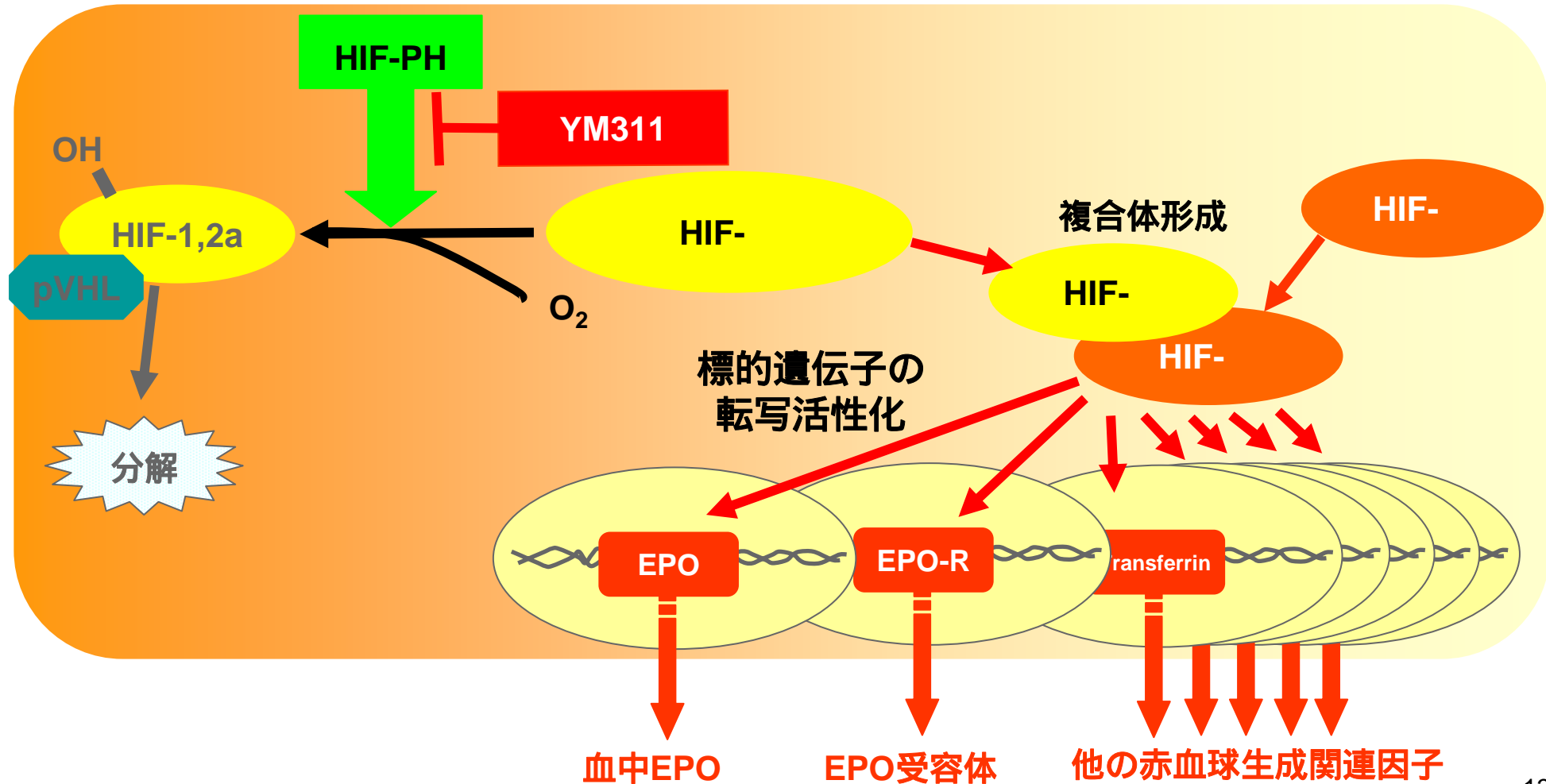
- プラセボに対し高い正常洞調律への復帰率  
(RSD1235:51-52%、プラセボ:4%)
- 効果が早く発現し(効果発現時間中央値:8-11分)、24時間持続
- 安全性が高い

■期待プロファイル：

- 文献記載の同効他剤に比べても、よい有効性・安全性プロファイルが期待できる
- 効果が早く発現することにより、患者の症状を一刻でも早く改善するとともに、医師の治療方針決断のタイミングを早め、また緊急治療室占有時間を短縮できるというメリットも想定できる

# FG-2216/YM311 作用機序

FG-2216/YM311は、低酸素誘発因子-プロリン水酸化酵素(HIF-PH)を阻害することにより、転写因子HIF- $\alpha$ 鎖を安定化させる。HIF- $\alpha$ 鎖は赤血球生成に関する複数の遺伝子発現を誘導する。



# ILY-101の概要

- **適応症:** 慢性腎不全に伴う高リン血症(透析期)
- **作用機序:** 非吸収性のリン酸吸着ポリマー
- **剤形:** 錠剤
- **期待プロファイル:**
  - 消化管内で食物中のリン酸と結合して糞便中へのリンの排泄を促進させることにより、消化管からのリン吸収を抑制し、高リン血症を改善する効果が期待される。
  - 水分吸収後の膨張率が低く、便秘、腹部膨満感、腹痛などの消化器系の副作用が少ないことが期待される。
  - 高いリン吸着能に基づく服用コンプライアンスの向上が期待される。
- **導入元:** Ilypsa Inc. (米国)
- **契約内容:** 日本での独占的開発・販売権

## 日本における腎臓疾患領域のパイプラインの充実

- YM086(糖尿病性腎症 P-III)、YM533(慢性腎不全 P-II)、YM311(腎性貧血 P-I) -

## 注意事項

- 資料中の業績見通し数値及び開発見通し等は、現時点において入手可能な情報から得られた当社経営陣による判断に基づくものですが、重大なリスクや不確実性を含んでいる情報から得られた多くの仮定及び考えに基づきなされたものであります。実際の成果は、さまざまな要素によりこれら業績見通し、開発見通し等とは大きく異なる結果となり得ることをご承知おき下さい。
- 実際の業績に影響を与える要素には、経済情勢の悪化、為替レートの変動、法律・行政制度の変化、新製品上市の遅延、競合会社の価格・製品戦略による圧力、当社既存及び新製品の販売力の低下、生産中断、当社の知的所有権に対する侵害、重大な訴訟における不利な判決等がありますが、これらに限定されるものではありません。
- 医薬品(開発中の物を含む)に関する情報が含まれておりますが、その内容は宣伝広告、医学的アドバイスを目的としているものではありません。