

## FLT3 阻害剤「ゾスパタ<sup>®</sup>錠 40 mg」

### 日本での新発売のお知らせ

—急性骨髄性白血病の患者さんに新たな治療選択肢を提供—

アステラス製薬株式会社(本社:東京、代表取締役社長 CEO:安川 健司、以下「アステラス製薬」)は、FLT3(FMS-like tyrosine kinase 3)阻害剤「ゾスパタ<sup>®</sup>錠 40 mg」(一般名:ギルテリチニブフマル酸塩)について、本日、日本において「再発又は難治性の FLT3 遺伝子変異陽性の急性骨髄性白血病」を効能・効果として発売しましたので、お知らせします。

急性骨髄性白血病(Acute Myeloid Leukemia: AML)は血液と骨髄に影響を及ぼすがんであり、加齢とともに患者数が増加します。日本では毎年約 5,500 人が新たに AML と診断されています\*1。また、AML 患者の約 30%でがん細胞の増殖に関与する受容体型チロシンキナーゼである FLT3 というタンパク質の変異が認められると報告されています。

ゾスパタ<sup>®</sup>錠は、FLT3 の活性化変異である、遺伝子内縦列重複変異(Internal Tandem Duplication: ITD)、チロシンキナーゼドメイン変異(Tyrosine Kinase Domain: TKD)のいずれの変異に対しても阻害活性を示すことで、変異を有する腫瘍細胞の増殖を抑制すると考えられています。

ギルテリチニブフマル酸塩は、2015年10月に日本において「初回再発又は治療抵抗性の FLT3 遺伝子変異陽性急性骨髄性白血病」で先駆け審査指定制度\*2の対象品目として指定を受け、2018年9月に国際共同第 III 相試験(ADMIRAL 試験)の中間解析における CR/CRh 率\*3の結果に基づき、「再発又は難治性の FLT3 遺伝子変異陽性の急性骨髄性白血病」を効能・効果として承認を取得しました。また、米国においても2018年11月28日(現地時間)に同様の適応症で承認を取得しています。

ゾスパタ<sup>®</sup>錠の投与にあたっては、コンパニオン診断薬(Companion Diagnostics: CDx)を用いた検査により患者さんが FLT3 遺伝子変異陽性であることを確認します。このアプローチは個々の患者さんに最適な治療薬を提供するプレジジョン・メディシン(精密医療)の推進に繋がるものと考えています。アステラス製薬は、ゾスパタ錠の発売により、AML の患者

さんとその治療に携わる医療関係者に新たな治療選択肢を提供することで、AML 治療に貢献していきます。

なお、本件による業績への影響は、2019年3月期連結業績予想に織り込み済みです。

以上

## 製品概要

製品名	ゾスパタ <sup>®</sup> 錠 40 mg
一般名	ギルテリチニブフマル酸塩
効能・効果	再発又は難治性の <i>FLT3</i> 遺伝子変異陽性の急性骨髄性白血病 <効能・効果に関連する使用上の注意>  (1)十分な経験を有する病理医又は検査施設における検査により、 <i>FLT3</i> 遺伝子変異陽性が確認された患者に投与すること。検査にあたっては、承認された体外診断薬を用いること。  (2)臨床試験に組み入れられた患者の遺伝子変異の種類等について、「臨床成績」の項の内容を熟知し、本剤の有効性及び安全性を十分に理解した上で、適応患者の選択を行うこと。
用法・用量	通常、成人にはギルテリチニブとして 120 mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、患者の状態により適宜増減するが、1 日 1 回 200 mg を超えないこと。
製造承認取得日	2018 年 9 月 21 日
薬価収載日	2018 年 11 月 20 日
発売日	2018 年 12 月 3 日

## 製品写真



### ギルテリチニブフマル酸塩(以下「ギルテリチニブ」)について

ギルテリチニブはアステラス製薬と寿製薬株式会社の共同研究により見出されました。アステラス製薬はギルテリチニブについて全世界での開発、製造、ならびに将来的な商業化に関する独占的な権利を有します。現在、アステラス製薬は、様々な治療セグメントの AML 患者さんを対象とした複数の第 III 相試験を実施し、ギルテリチニブの有効性および安全性を検証しています。現在進行中のギルテリチニブの臨床試験詳細については <http://www.clinicaltrials.gov> をご覧ください。

### ADMIRAL 試験について

第 III 相 ADMIRAL 試験 ([NCT02421939](https://clinicaltrials.gov/ct2/show/study/NCT02421939)) は、AML に対する一次治療後に再発した、または一次治療抵抗性の FLT3 遺伝子変異陽性の成人 AML 患者を対象として、ギルテリチニブと救済化学療法<sup>\*4</sup> を比較する非盲検<sup>\*5</sup> 多施設無作為化試験として実施されています。本試験の主要評価項目は全生存期間 (Overall Survival: OS) および完全寛解 (CR) と部分的血液学的回復を伴う完全寛解 (CRh) の割合 (CR/CRh 率<sup>\*3</sup>) です。本試験では骨髄あるいは全血において FLT3 遺伝子変異陽性と中央測定機関<sup>\*6</sup> で判定された患者 371 名が組み入れられました。患者は 2:1 の割合でギルテリチニブ (120 mg<sup>\*7</sup> を 1 日 1 回) または救済化学療法<sup>\*4</sup> のいずれかを投与する群に無作為に割付けられました。

\*1: Annual Incidence in 2017 in U.S., EU5 and JP. CancerMPact (Synix Inc./Kantar Health)

\*2 先駆け審査指定制度: 先駆け審査指定制度の内容は、①優先相談、②事前評価の充実、③優先審査の 3 つの取り組みで承認取得期間の短縮を実施、④審査パートナー制度 (独立行政法人 医薬品医療機器総合機構が実施)、⑤製造販売後の安全対策充実の 2 つの取り組みで、開発の促進を支援するもの。

- \*3 **CR/CRh 率**:完全寛解(CR)と部分的血液学的回復を伴う完全寛解(CRh)の割合のこと。
- \*4 **救援化学療法**:主に血液がんにおいて、一次治療で効果が得られない場合(治療抵抗性)、または一次治療後に再発・再燃した場合に用いる治療法のこと。サルベージ化学療法と呼ばれることもある。
- \*5 **非盲検試験**:被験者にどの治療が割り付けられたかについて医師、被験者、スタッフ全員に知られている試験のこと。
- \*6 **中央測定機関**:多施設共同で行う試験において、臨床検査の測定における施設間差を臨床検査値の集計に持ち込まないために、プロトコルが要求する臨床検査を1つの測定機関で測定することがある。
- \*7 Gorcea CM, Burthem J, Tholouli E. ASP2215 in the treatment of relapsed/refractory acute myeloid leukemia with FLT3 mutation: background and design of the ADMIRAL trial. Future Oncol (Epub) 03-02-2018.

### アステラス製薬について

アステラス製薬株式会社は、東京に本社を置き、「先端・信頼の医薬で、世界の人々の健康に貢献する」ことを経営理念に掲げる製薬企業です。アステラス製薬の詳細については、(<https://www.astellas.com/jp/>)をご覧ください。

### 注意事項

このプレスリリースに記載されている現在の計画、予想、戦略、想定に関する記述およびその他の過去の事実ではない記述は、アステラス製薬の業績等に関する将来の見通しです。これらの記述は経営陣の現在入手可能な情報に基づく見積りや想定によるものであり、既知および未知のリスクと不確実な要素を含んでいます。さまざまな要因によって、これら将来の見通しは実際の結果と大きく異なる可能性があります。その要因としては、(i)医薬品市場における事業環境の変化および関係法規制の改正、(ii)為替レートの変動、(iii)新製品発売の遅延、(iv)新製品および既存品の販売活動において期待した成果を得られない可能性、(v)競争力のある新薬を継続的に生み出すことができない可能性、(vi)第三者による知的財産の侵害等がありますが、これらに限定されるものではありません。また、このプレスリリースに含まれている医薬品(開発中のものを含む)に関する情報は、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。

---

### お問い合わせ先:

アステラス製薬株式会社

広報部

TEL: 03-3244-3201 FAX: 03-5201-7473