

イノベーションに情熱を。
ひとに思いやりを。



2020年度 第3四半期 決算説明会

第一三共株式会社

代表取締役副社長 兼 CFO
齋 寿明

2021年1月29日

将来の見通しに関する注意事項

本書において当社が開示する経営戦略・計画、業績予想、将来の予測や方針に関する情報、研究開発に関する情報等につきましては、全て将来を見込んだ見解です。これらの情報は、開示時点で当社が入手している情報に基づく一定の前提・仮定及び将来の予測等を基礎に当社が判断したものであり、これらには様々なリスク及び不確実性が内在しております。従いまして、実際の当社の業績は、当社の見解や開示内容から大きくかい離する可能性があることをご留意願います。また、本書において当初設定した目標は、全て実現することを保証しているものではありません。なお、実際の結果等にかかわらず、当社は本書の日付以降において、本書に記述された内容を随時更新する義務を負うものではなく、かかる方針も有していません。

本書において当社が開示する開発中の化合物は治験薬であり、開発中の適応症治療薬としてFDA等の規制当局によって承認されてはおりません。これらの化合物は、対象地域においてまだ有効性と安全性が確立されておらず、開発中の適応症で市販されることを保証するものではありません。

当社は、本書に記載された内容について合理的な注意を払うよう努めておりますが、記載された情報の内容の正確性、適切性、網羅性、実現可能性等について、当社は何ら保証するものではありません。また、本書に記載されている当社グループ以外の企業・団体その他に係る情報は、公開情報等を用いて作成ないし記載したものであり、かかる情報の正確性、適切性、網羅性、実現可能性等について当社は独自の検証を行っておらず、また、これを何ら保証するものではありません。

本書に記載の情報は、今後予告なく変更されることがあります。従いまして、本書又は本書に記載の情報の利用については、他の方法により入手した情報とも照合し、利用者の判断においてご利用ください。

本書は、米国又は日本国内外を問わず、いかなる証券についての取得申込みの勧誘又は販売の申込みではありません。

本書は投資家判断の参考となる情報の公開のみを目的としており、投資に関する最終決定はご自身の責任においてご判断ください。

当社は、本書に記載された情報の誤り等によって生じた損害について一切責任を負うものではありません。

本日本話する内容

① 2020年度 第3四半期 連結決算

② ビジネスアップデート

③ 研究開発アップデート

④ Appendix



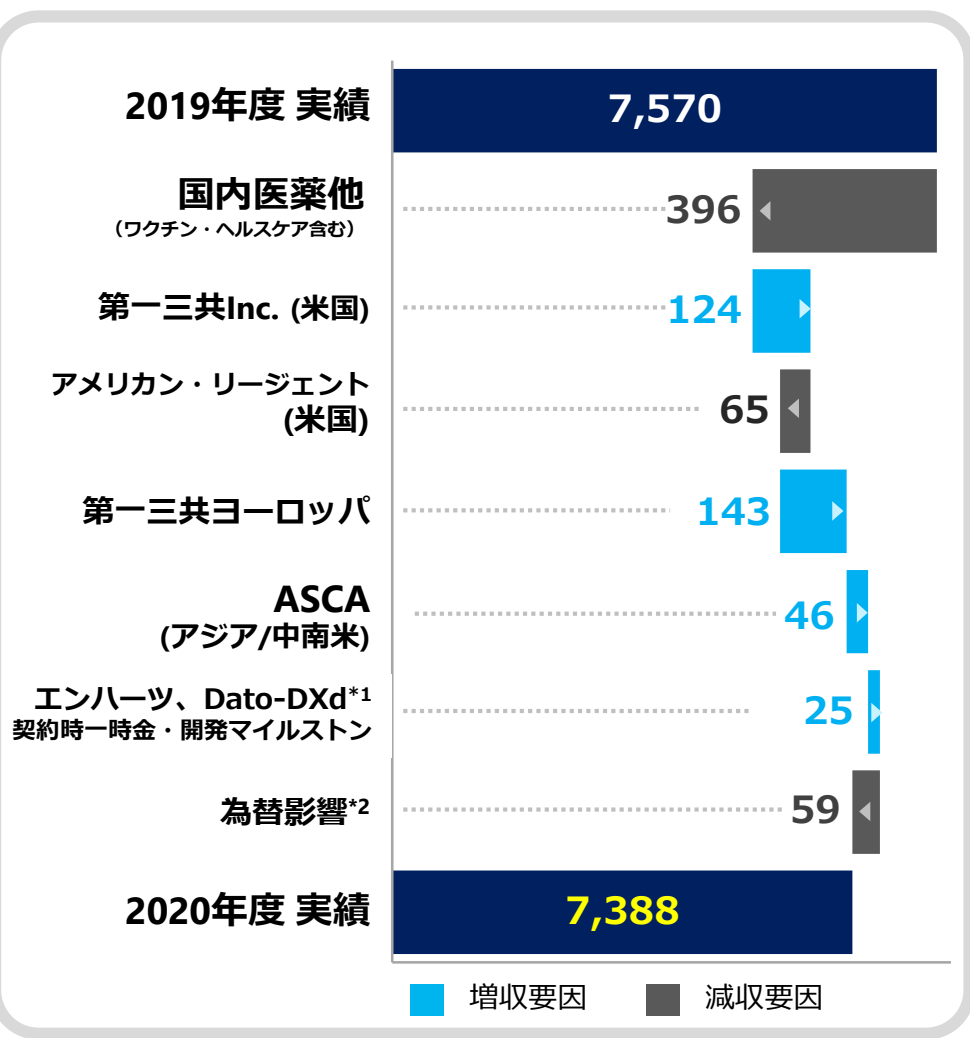
連結業績の概要

(単位：億円)

		2019年度 第3四半期累計実績	2020年度 第3四半期累計実績	増減額
売上収益		7,570	7,388	-2.4% -182
売上原価		2,563	2,564	1
販売費・一般管理費		2,082	2,293	210
研究開発費		1,369	1,636	267
営業利益		1,556	895	-42.5% -661
税引前利益		1,600	996	-604
当期利益 (親会社帰属)		1,343	758	-43.5% -585
為替 レート	USD/円	108.67	106.11	-2.56
	EUR/円	121.05	122.37	+1.32

182億円減収 (為替影響除き実質123億円減収)

(単位：億円)



増収		減収	
国内医薬			
タリージェ	+99	メモリー	-233
		イナビル	-93
		リクシアナ	-58
第一三共エスファ メマンチンAG、エゼチミブAG等	+73	ワクチン事業 アクトヒブ等	-145
		第一三共ヘルスケア ルル等	-14
第一三共Inc. (米国)			
エンハーツ	+185	ウェルコール	-46
アメリカン・リージェント (米国)			
		インジェクタファー	-63
第一三共ヨーロッパ			
リクシアナ	+116		
長期収載品譲渡益	+45		
エンハーツ、Dato-DXd*1 契約時一時金・開発マイルストーン			
Dato-DXd 契約時一時金	+25		

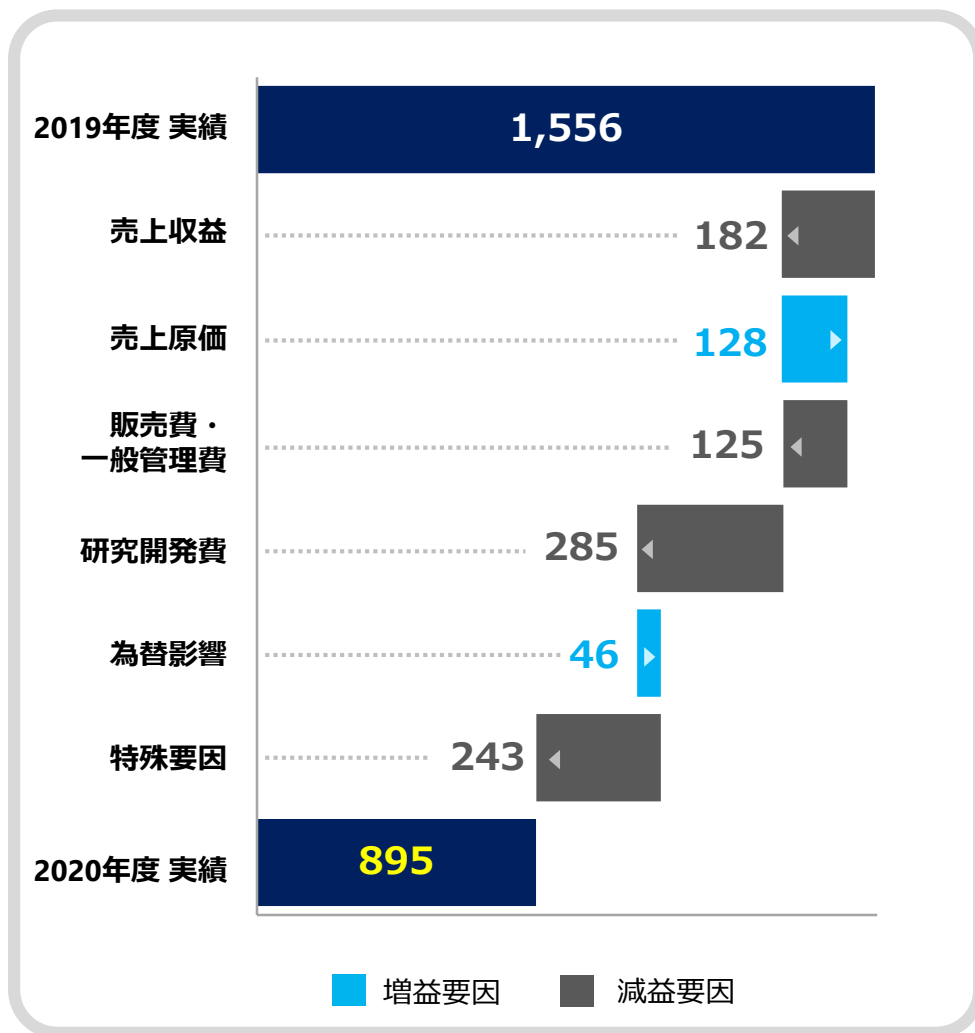
*1 Dato-DXd：ダトポタマブ デルクステカン (DS-1062)

*2 為替影響の内訳 USD：-32億円、EUR：+9億円、アジア/中南米：-36億円

営業利益増減

661億円減益 (為替・特殊要因除き実質404億円減益)

(単位：億円)



売上収益 -182

為替影響 -59を含む

売上原価 -128 (利益増)

- ・ 売上収益の減収に伴う原価減
- ・ プロダクトミックスの変化に伴う原価率改善

販売費・ +125 (利益減)

一般管理費

エンハーツに係る費用増
(販促費及びAZ社とのプロフィット・シェアを含む)

研究開発費 +285 (利益減)

- ・ 3 ADC*の研究開発投資の増加
- ・ がんPJ開発体制の強化に伴う費用増

為替影響 -46 (利益増)

売上原価 -7

販売費・一般管理費 -21

研究開発費 -18

特殊要因 +243 (利益減)

明細は次ページ

*3ADC：①エンハーツ、トラスツマブ デルクステカン (T-DXd、DS-8201)、②ダトポタマブ デルクステカン (Dato-DXd、DS-1062) および③パトリツマブ デルクステカン (HER3-DXd、U3-1402)

特殊要因の内訳

(単位：億円)

	2019年度 第3四半期累計実績	2020年度 第3四半期累計実績	増減額
売上原価	サプライチェーン体制 再編費用	13	
	減損（無形資産） ^{*1}	38	-
	子会社売却益 ^{*2}	-188	
			137
販売費・一般管理費	有形固定資産売却益 ^{*3}	-106	-
研究開発費		-	-
計		-243	-
			243

-：費用減少要因

*1 モルファボンド・ロキシボンド

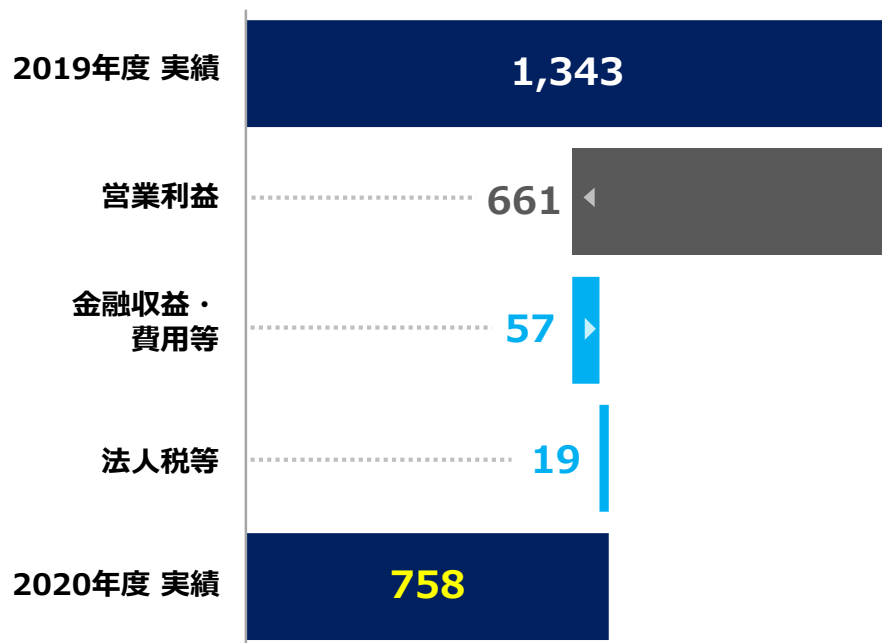
*2 高槻工場譲渡益

*3 日本橋ビル

特殊要因：一過性かつ多額の営業利益変動要素、具体的には1件当たり10億円以上となる「固定資産売却」、「事業再編」、「減損」、「訴訟」等に関連する利益・損失

当期利益（親会社帰属）増減

585億円減益



■ 増益要因 ■ 減益要因

(単位：億円)

金融収益・費用等 -57 (利益増)

- ・ キザルチニブ獲得時の条件付対価の減額に伴う金融収益の計上 -48
- ・ 為替差損益の改善 -23

法人税等 -19 (利益増)

	2019年度 第3四半期累計	2020年度 第3四半期累計	増減額
税引前利益	1,600	996	-604
法人税等	258	239	-19
税率	16.1%	24.0%	7.9%

参考：前年同期の税率が連結納税制度の導入等の影響に伴い低かったため、税率が前年同期に比べ増加

主要ビジネスユニット 売上収益増減 (為替影響を含む)

(単位：億円)

	2019年度 第3四半期累計実績	2020年度 第3四半期累計実績	増減額
国内医薬+ワクチン	4,223	3,864	-359
第一三共ヘルスケア	529	515	-14
第一三共Inc.	238	354	+116
エンハーツ	0	180	+180
オルメサルタン	78	72	-6
ウェルコール	86	39	-47
アメリカン・リージェントInc.	997	910	-87
インジェクタファー	393	322	-71
ヴェノファー	233	222	-12
GE注射剤	321	313	-7
第一三共ヨーロッパ	677	829	+152
リクシアナ	439	560	+122
オルメサルタン	169	162	-7
エフィエント	19	12	-8
ASCA (アジア/中南米)	735	745	+10

為替	USD/円	108.67	106.11	-2.56
レート	EUR/円	121.05	122.37	+1.32

国内主要製品 売上収益増減

(単位：億円)

		2019年度 第3四半期累計実績	2020年度 第3四半期累計実績	増減額
ネキシウム	抗潰瘍剤	623	608	-15
リクシアナ	抗凝固剤	656	598	-58
プラリア	骨粗鬆症治療剤・関節リウマチに伴う 骨びらの進行抑制剤	243	264	+21
メマリー	アルツハイマー型認知症治療剤	402	169	-233
テネリア	2型糖尿病治療剤	197	192	-5
ロキソニン	消炎鎮痛剤	227	191	-36
ランマーク	がん骨転移による骨病変治療剤	140	149	+9
イナビル	抗インフルエンザウイルス剤	115	23	-93
タリージェ	疼痛治療剤	54	153	+99
カナリア	2型糖尿病治療剤	98	119	+21
ビムパット	抗てんかん剤	85	112	+27
エフィエント	抗血小板剤	111	110	-1
レザルタス	高血圧症治療剤	116	104	-12
オルメテック	高血圧症治療剤	94	74	-20
エンハーツ	抗悪性腫瘍剤 (抗HER2抗体薬物複合体)	-	27	+27

① 2020年度 第3四半期 連結決算

② **ビジネスアップデート**

③ 研究開発アップデート

④ Appendix



エンハーツ®：製品価値最大化の取り組み

- ◆ 製品売上 2020年度 第3四半期累計：207億円 <米国 180億円、日本 27億円>
- ◆ 順調な販売国および適応の拡大



HER2陽性 乳がん 3次治療

- 米国
2020年 1月 上市*1
- 日本
2020年 5月 上市*2
- EU
2021年 1月 承認を取得*³



HER2陽性 胃がん 3次治療

- 日本
2020年 9月
適応拡大*4
- HER2陽性 胃がん
2次治療
- 米国
2021年 1月 適応拡大*⁵

赤字下線：FY2020 Q2からのアップデート

- *1 転移性の乳がんに対する治療として2つ以上の抗HER2療法を受けたHER2陽性の手術不能又は転移性乳がん
- *2 化学療法歴のあるHER2陽性の手術不能又は再発乳癌（標準的な治療が困難な場合に限る）
- *3 2つ以上の抗HER2療法を受けた手術不能または転移性のHER2陽性乳がん
- *4 がん化学療法後に増悪したHER2陽性の治癒切除不能な進行・再発の胃癌
- *5 トラスツズマブを含む前治療を受けたHER2陽性の局所進行または転移性の胃腺がんまたは胃食道接合部腺がん

エンハーツ® : 売上収益

(単位：億円)

	2020年度 第3四半期累計 実績	2020年度 予想		(参考) 確定受領対価 総計
			(対10月公表)	
製品売上	207	349	-	-
日本	27	56	-	-
米国	180	292	-	-
契約時一時金	74 ^{*1}	98 ^{*1}	-	1,490
開発マイルストーン	7 ^{*1}	37 ^{*1}	+12	346
米国 HER2陽性 乳がん 3L	7	9	-	137
欧州 HER2陽性 乳がん 3L	-	11 ^{*2}	-	83 ^{*2}
米国 HER2陽性 胃がん 2L+3L	-	17 ^{*2}	+12	127 ^{*2}
計	288	483	+12	1,836

*1 当該期収益認識分

*2 \$1 = 110円換算

各地域の事業成長に向けた取り組み

◆ 製品ポートフォリオの強化と製品価値最大化の取り組みが順調に進展

日本

片頭痛発作の
発症抑制薬
エムガルティ®
2021年 1月
承認

大細胞型B細胞
リンパ腫治療製品
イエスカルタ®
2021年 1月
承認

抗てんかん剤
ビムパット®
2020年 12月
適応拡大*1

欧州

高コレステロール血症治療剤
NILEMDO®および**NUSTENDI®**
2020年 11月
ドイツ上市

*1 てんかん患者の強直間代
発作に対する併用療法

ASCA*2

抗凝固剤 **リクシアナ (里先安®)**
2020年 12月
中国の**国家医療保険リスト**収載
(2021年3月1日から施行開始予定)

*2 アジア・中南米地域

欧州：新製品の上市

- ◆ Esperion社から導入した高コレステロール血症治療剤**NILEMDO®**および**NUSTENDI®**を**2020年11月にドイツで上市**（順次欧州での上市国を拡大予定）



NILEMDO® (bempedoic acid)

- ◆ ベムペド酸の単剤
- ◆ ファーストインクラスの経口ACL*阻害剤
- ◆ 本剤を脂質低下療法にアドオンすることでプラセボと比較して、LDL-Cを最大28%低下

NUSTENDI® (bempedoic acid and ezetimibe)

- ◆ ベムペド酸とエゼチミブの配合剤
- ◆ コレステロールを低下させる2つの補完的な作用を組み合わせた配合剤
ベムペド酸：コレステロールの産生を抑制
エゼチミブ：腸内の食事性コレステロールの吸収を低下
- ◆ ハイリスク患者において最大耐用量のスタチンにアドオンすることで、プラセボと比較してLDL-Cを38%低下

適応症：高脂血症および脂質異常症の成人患者

- ◆ 抗凝固剤リクシアナとのシナジー効果により欧州リージョナルバリューを向上

*ACL: アデノシン三リン酸クエン酸リアーゼ（肝臓でのコレステロール生成に関与する酵素）

① 2020年度 第3四半期 連結決算

② ビジネスアップデート

③ 研究開発アップデート

④ Appendix



3 ADC アップデート

Alphaアップデート

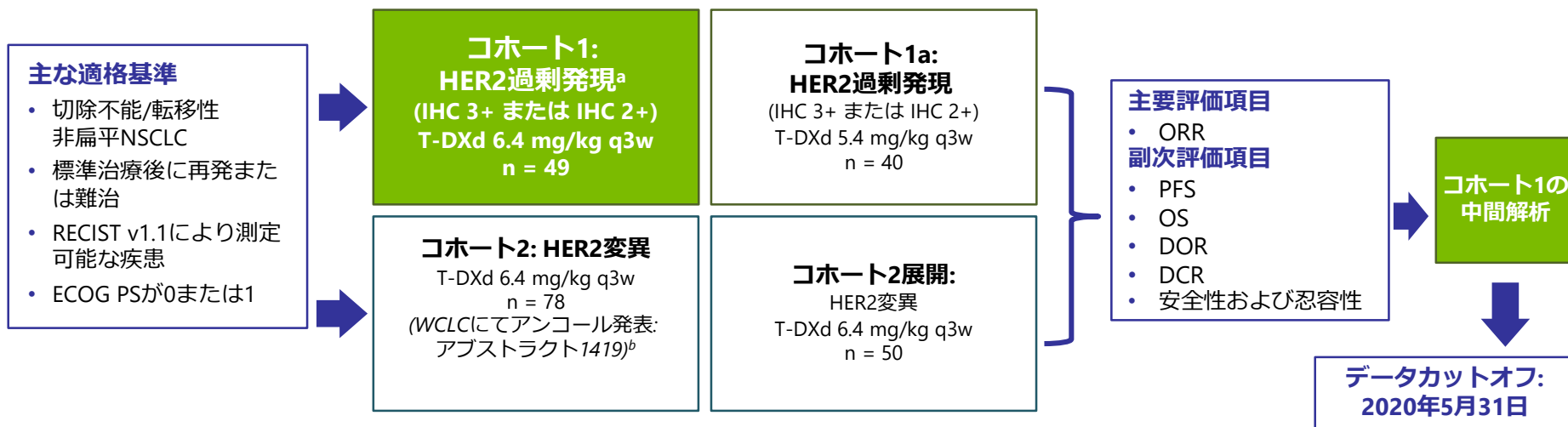
今後のニュースフロー

今後のIR資料での使用名について

- ◆ DS-8201/トラスツズマブ デルクステカン
=> エンハーツ®/T-DXd
- ◆ DS-1062/ダトポタマブ デルクステカン
=> Dato-DXd
- ◆ U3-1402/パトリツマブ デルクステカン
=> HER3-DXd

エンハーツ® : DESTINY-Lung01試験デザイン

HER2過剰発現またはHER2変異 転移性NSCLC患者を対象とした 新規抗体薬物複合体であるT-DXdの第2相試験 (NCT03505710)



- コホート1では、11人の患者が治療継続、38人の患者が主にPD (n = 22) またはAE (n = 9) のために治療を中止^c
- 治療期間中央値は18.0週 (幅, 3.0-57.1週)

AE, adverse event; DCR, disease control rate; OS, overall survival; PD, progressive disease; q3w, every 3 weeks.

^aHER2 overexpression (without known HER2 mutation) was assessed by local assessment of archival tissue and centrally confirmed. ^bSmit EF et al. Presented at: 2020 World Conference on Lung Cancer Singapore, Virtual Meeting; January 28-31, 2021. ^cOther reasons for discontinuation included death (n = 2; unrelated to study treatment), withdrawal of consent (n = 2), investigator decision (n = 2), and other (n = 1).

DESTINY-Lung01 (HER2陽性) : 患者背景

患者背景	患者数(N = 49)
年齢中央値 (幅), 歳	63.0 (37-85)
65歳未満, n (%) 75歳以上, n (%)	27 (55.1%) 2 (4.1%)
女性, n (%)	19 (38.8%)
地域, n (%)	
アジア	12 (24.5%)
北米	19 (38.8%)
ヨーロッパ	18 (36.7%)
HER2 IHCステータス, n (%)	
IHC 3+	10 (20.4%)
IHC 2+	39 (79.6%)
IHC 1+ IHC 0 不明	0 0 0

患者背景	患者数(N = 49)
他の遺伝子異常ステータス, n (%)	
EGFR/ALK/ROS1/BRAF	3 (6.1%)
EGFR/ALK/ROS1/BRAFなし	14 (28.6%)
未報告	32 (65.3%)
ECOGパフォーマンスステータス, n (%) 0 1	14 (28.6%) 35 (71.4%)
CNS転移あり, n (%)	17 (34.7%)
前治療あり, n (%)	49 (100.0%)
プラチナベース 抗PD-1/PD-L1 ドセタキセル	45 (91.8%) 36 (73.5%) 12 (24.5%)
過去の治療ライン数の中央値 (幅)	3 (1-8)

CNS, central nervous system; ECOG, Eastern Cooperative Oncology Group; PD-1, programmed death 1; PD-L1, programmed death ligand 1. Full analysis set data are shown.

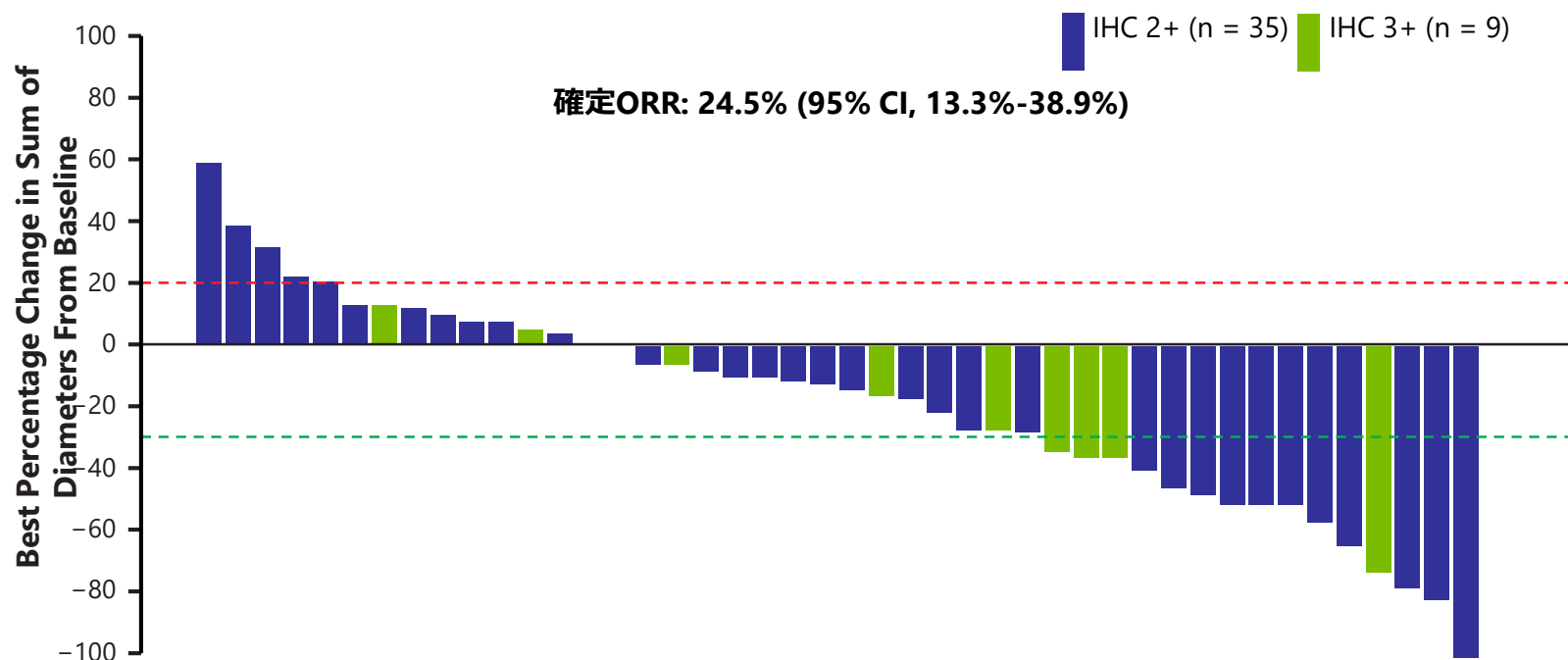
DESTINY-Lung01 (HER2陽性) : 有効性

ICRで評価されたレスポンス	IHC 3+ (n = 10)	IHC 2+ (n = 39)	Overall (N = 49)
確定ORR, n (95% CI)	20.0% 2 (2.5-55.6)	25.6% 10 (13.0-42.1)	24.5% 12 (13.3-38.9)
CR, n (%)	0	1 (2.6%)	1 (2.0%)
PR, n (%)	2 (20.0%)	9 (23.1%)	11 (22.4%)
SD, n (%)	6 (60.0%)	16 (41.0%)	22 (44.9%)
PD, n (%)	1 (10.0%)	10 (25.6%)	11 (22.4%)
評価不能, n (%)	1 (10.0%)	3 (7.7%)	4 (8.2%)
DCR, n (95% CI)	80.0% 8 (44.4-97.5)	66.7% 26 (49.8-80.9)	69.4% 34 (54.6-81.8)
DOR中央値, 月数 (95% CI)	6.0 (NE-NE)	5.8 (3.2-NE)	6.0 (3.2-NE)

CR, complete response; PR, partial response; SD, stable disease.
Full analysis set data are shown.

◆ 奏効率は24.5%

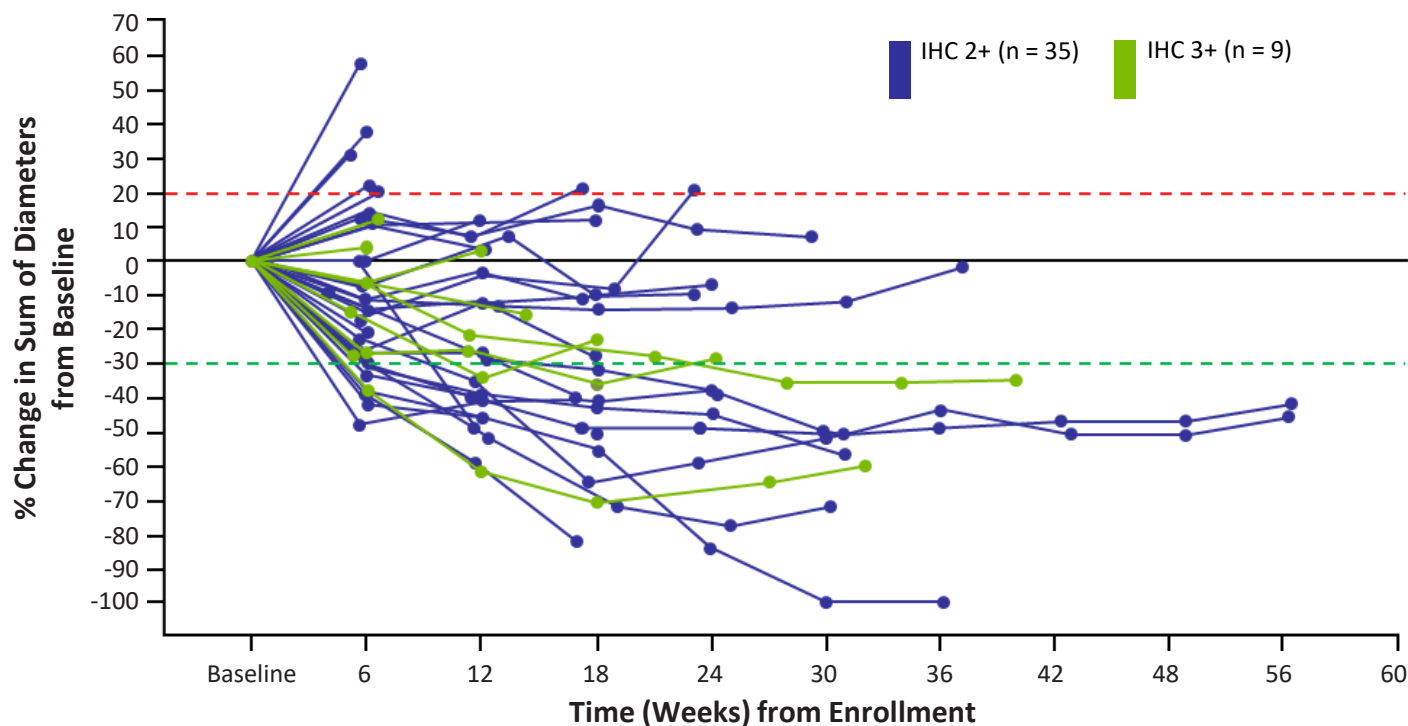
T-DXdによる腫瘍サイズの最大変化^a



^aBest (minimum) percentage change from baseline in the sum of diameters for all target lesions, based on ICR. Baseline was last measurement taken before enrollment. Red line at 20% indicates PR, and green line at -30% indicates PR (when considering only target lesions). Full analysis set data are shown.

◆ IHC3+とIHC2+両方のコホートで有効性を確認

腫瘍サイズの経時的変化



Baseline is defined as the last measurement taken before enrollment. Data beyond first determination of progressive disease or start of new antineoplastic therapy are not displayed. Red line at 20% indicates PD, and green line at -30% indicates PR (when considering only target lesions). Plot is based on ICR and in the full analysis set.

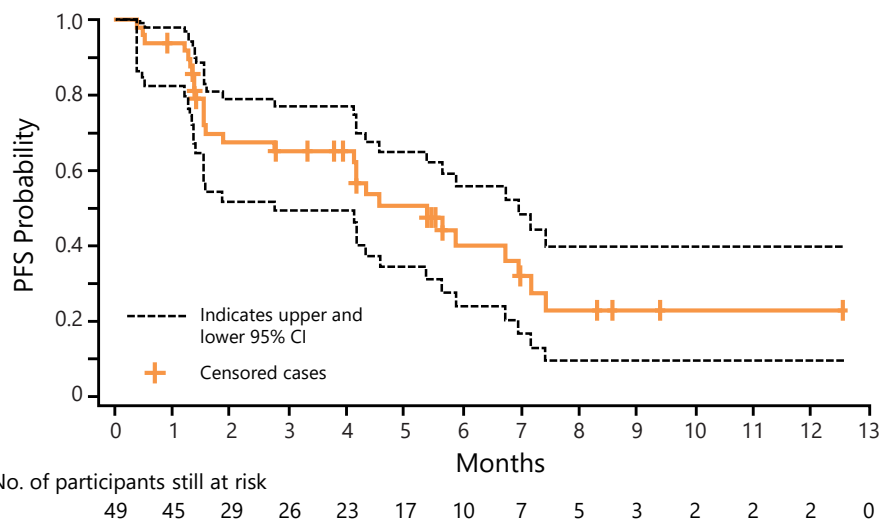
◆ 持続的な効果が認められた

DESTINY-Lung01 (HER2陽性) : 有効性

PFSおよびOS

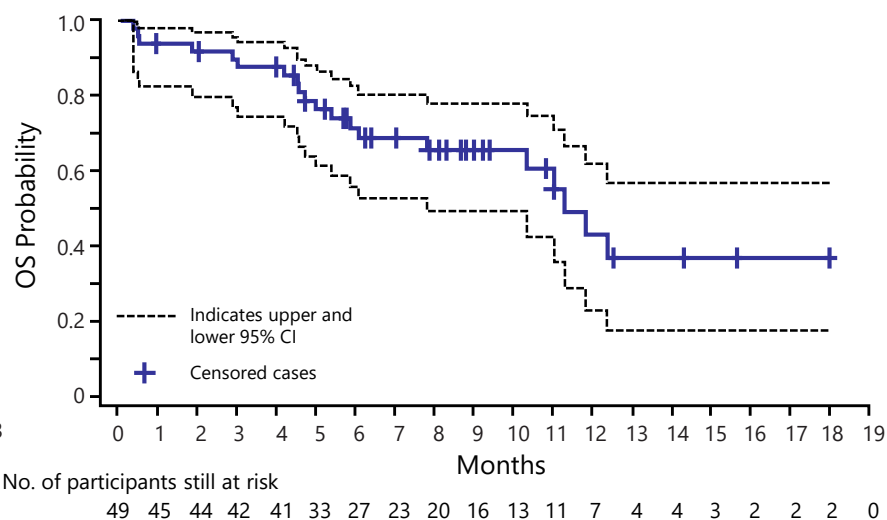
PFS (N = 49)

Median: 5.4 months (95% CI, 2.8-7.0 months)



OS (N = 49)

Median: 11.3 months (95% CI, 7.8-NE)



Progressive disease was assessed by ICR using Response Evaluation Criteria in Solid Tumors, version 1.1 (RECIST v1.1). The median was based on Kaplan-Meier estimate; 95% CI for the median was computed using the Brookmeyer-Crowley method. Median follow-up was 6.1 months (range, 0.4-18.0 months). Full analysis set data are shown.

◆ PFS中央値は5.4か月、OS中央値は11.3か月

DESTINY-Lung01 (HER2陽性) : 安全性

有害事象のタイプ ^a	患者数, n (%) N = 49
全TEAE	49 (100.0%)
薬剤との関連あり	44 (89.8%)
グレード3以上のTEAE	36 (73.5%)
薬剤との関連あり	27 (55.1%)
重篤なTEAE	22 (44.9%)
薬剤との関連あり	8 (16.3%)
投与中止に関連したTEAE	11 (22.4%)
薬剤との関連あり	6 (12.2%)
投与量の減量に関連したTEAE	17 (34.7%)
薬剤との関連あり	16 (32.7%)
投与中断に関連したTEAE	26 (53.1%)
薬剤との関連あり	17 (34.7%)

有害事象のタイプ ^a	患者数, n (%) N = 49
グレード3以上のTEAE (>15%)	
好中球数減少	10 (20.4%)
投与中止に関連したTEAE ^b	
肺炎	5 (10.2%)
投与量の減量に関連したTEAE ^b	
好中球数減少	5 (10.2%)
倦怠感	4 (8.2%)
嘔気	3 (6.1%)
投与中断に関連したTEAE ^b	
好中球数減少	5 (10.2%)
嘔気	3 (6.1%)
グレード5のTEAE ^c 薬剤との関連あり	7 (14.3%) 1 (2.0%)

- 治療期間中央値は18週 (幅, 3.0-57.1週)

TEAE, treatment-related adverse event.

^aRelationship to study drug was determined by the treating investigator. ^bMost common occurring in more than 2 patients. ^cThe grade 5 TEAEs included disease progression (n = 4), hydrocephalus, pneumonitis, and bronchospasm (n = 1 each).

Safety analysis set data are shown.

◆ 安全性のプロファイルはエンハーツの他の試験と同様

特記すべき有害事象: ILD

全患者数 (N = 49)						
n (%)	グレード 1	グレード 2	グレード 3	グレード 4	グレード 5	全グレード/合計
薬剤と関連があると判定された ILD ^a	2 (4.1%)	3 (6.1%)	0	0	3 (6.1%)	8 (16.3%)

薬剤と関連があると判定された ILD^b

- 発症までの期間中央値は64.5日 (幅, 2-126日)
- 全患者で薬剤の投与は中止
- グレード2 (n = 3) とグレード5 (n = 3) のILDを発現した患者はステロイドで治療
- 3人の患者は回復 (グレード1 [n = 1] とグレード2 [n = 2]), データカットオフの時点で2人の患者は未回復 (グレード1 [n = 1] とグレード2 [n = 1])
- 8人中4人の患者は、前治療として免疫チェックポイント阻害剤の使用していた

グレード5のILD^c

- 3人の患者の既往歴
 1. 肺塞栓症、湿性咳嗽、呼吸困難、胸水、および肺葉切除; 4ラインの前治療
 2. 咳、呼吸困難、胸水、および肺塞栓症; 5ラインの前治療
 3. 呼吸困難、肺病変のないSLE、およびTTP; 1ラインの前治療
- ステロイド治療は、治験医師によってイベントが報告されてから5日以内に開始^d
- 全員が以前に免疫チェックポイント阻害剤を投与されていた
- 主な死因は、病勢進行が2例、肺炎が1例だった

ILD, interstitial lung disease; SLE, systemic lupus erythematosus; TTP, thrombotic thrombocytopenic purpura.

^aDrug-related ILD was determined by an independent ILD adjudication committee based on 44 preferred terms. ^bAll potential cases of ILD that occurred before the data cutoff were adjudicated. ^cThe 3 cases of grade 5 ILD were initially reported by the investigator as grade 4 pneumonitis and grade 4 respiratory failure (n = 1), grade 4 respiratory failure (n = 1), and grade 5 pneumonitis (n = 1). ^dSteroid treatment was initiated 2 days later for case 1, 5 days later for case 2, and on the same day for case 3. Safety analysis set data are shown

◆ ILDについては注意深いモニタリングと迅速な治療で対応

T-DXdはHER2過剰発現NSCLC患者において 抗腫瘍活性の兆候を示した

有効性結果

- 前治療歴中央値3ライン（範囲、1～8）の広範囲な治療を受けた患者において、T-DXd 6.4 mg / kgは以下を示した
 - 奏効率は24.5%、HER2発現 (IHC 3+ vs 2+) による奏効率の明確な違いはなかった
 - DCRは69.4%およびOS中央値は11.3ヵ月

安全性結果

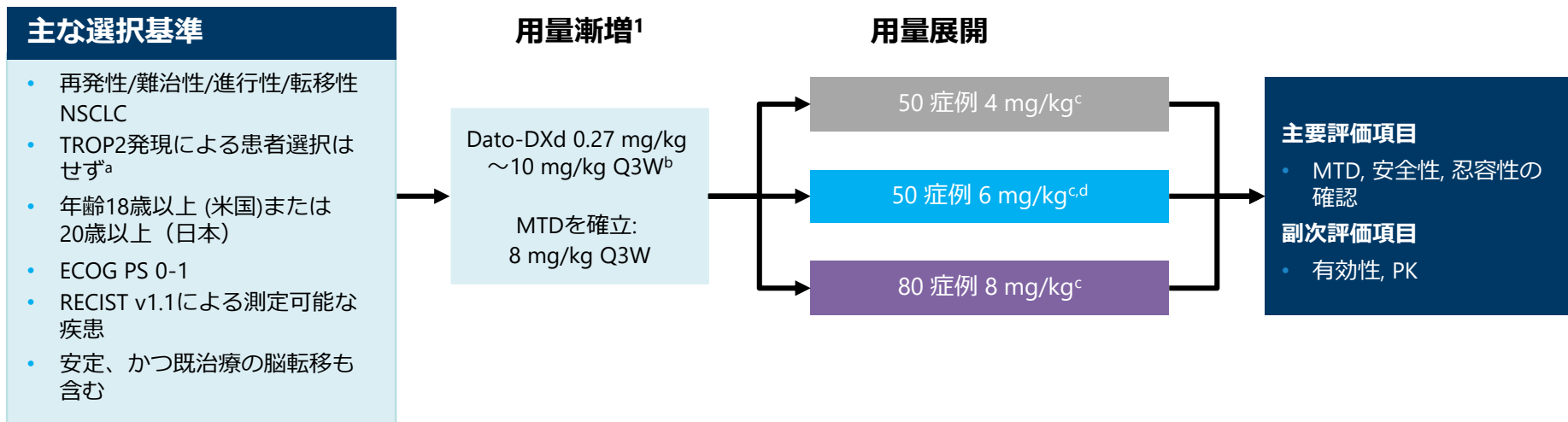
- 安全性プロファイルは、以前の試験と概ね一致¹⁻⁵
- 49人の患者を対象としたこの中間解析において、薬剤に関連したILDが患者の16.3%で発生し、患者の6.1%で死亡が認められた。ILDについては引き続き注意深くモニター、プロアクティブに管理し、より多くのフォローアップデータが得られた際さらに調査を実施する。

将来の試験

- これらの有望な初期の有効性の結果は、HER2過剰発現NSCLC患者におけるT-DXdの継続的な探索を支持する

1. Tsurutani J et al. *Cancer Discov.* 2020;10(5):688-701. 2. Tamura K et al. *Lancet Oncol.* 2019;20(6):816-826. 3. Modi S et al. *N Engl J Med.* 2020;382(7):610-621. 4. Modi S et al. *J Clin Oncol.* 2020;38(17):1887-1896. 5. Shitara K et al. *Lancet Oncol.* 2019;20(6):827-836.

フェーズ1 用量漸増および用量展開試験



- NSCLC患者の登録は完了^d
- TNBCコホート 6 mg/kg Q3Wは登録中; その他がん種コホートを追加する可能性あり
- NSCLCの用量展開コホート(Dato-DXd 4, 6, または 8 mg/kgにて175例が治療) のアップデートされた結果について発表

^aPretreatment tumor tissue was required for retrospective analysis of TROP2 expression. ^bThe 4, 6, and 8 mg/kg dose levels are being further evaluated for safety and efficacy. A TNBC cohort is currently open for enrollment at 6 mg/kg, although no TNBC patients are included in this analysis. ^cInclusive of patients treated in dose escalation and dose expansion. ^dThe current analysis includes 45 patients treated at the 6 mg/kg dose (data cutoff: 4 September 2020).

ECOG PS, Eastern Cooperative Oncology Group performance status; FIH, first-in-human; MTD, maximum tolerated dose; NSCLC, non-small cell lung cancer; PK, pharmacokinetics; RECIST v1.1, Response Evaluation Criteria in Solid Tumors version 1.1; TNBC, triple-negative breast cancer; TROP2, trophoblast cell surface antigen 2; Q3W, once every 3 weeks; US, United States.

1. Lisberg AE, et al. Presented at: ASCO Annual Meeting; May 29-June 2, 2020; virtual meeting. Abstract 9619.

TROPION-PanTumor01 : 患者背景

患者背景	Dato-DXd用量		
	4 mg/kg (n = 50)	6 mg/kg (n = 45)	8 mg/kg (n = 80)
男性, n (%)	27 (54)	26 (58)	41 (51)
年齢中央値 (幅), 歳	61 (35-82)	62 (45-76)	64 (31-84)
米国, n (%); 日本, n (%)	29 (58); 21 (42)	36 (80); 9 (20)	63 (79); 17 (21)
ECOG PS 0, n (%)	21 (42)	8 (18)	16 (20)
非扁平上皮がん, n (%)	41 (82)	40 (89)	70 (88)
3剤以上の治療歴, n (%)	25 (50)	26 (58)	51 (64)
過去の全身治療歴, n (%)			
免疫療法	42 (84)	35 (78)	70 (88)
プラチナベースの化学療法	44 (88)	43 (96)	78 (98)
チロシンキナーゼ阻害剤	10 (20)	6 (13)	14 (18)
脳転移歴, n (%)	19 (38)	15 (33)	32 (40)
EGFR 変異, ^a n (%)	8 (16)	3 (7)	15 (19)

Data cutoff: 4 September 2020.

^a*Alk* fusions were found in 1 patient treated with 4 mg/kg and 1 patient treated with 6 mg/kg.

AE, adverse event; ECOG PS, Eastern Cooperative Oncology Group performance status; EGFR, epidermal growth factor receptor.

TROPION-PanTumor01 : 治療の状況

- フォローアップ期間中央値は7.4カ月 (幅, 0.10-21.7カ月)
 - Dato-DXd 4 mg/kgおよび6mg/kgで治療された患者のフォローアップ期間は、8 mg / kgよりも短い
- 4mg/kgまたは6 mg/kgを投与された患者と比較して、8 mg/kgを投与された患者は、AEのために治療を中止する頻度が高く、また、相対用量強度の中央値が低かった

	Dato-DXdの用量		
	4 mg/kg (n = 50)	6 mg/kg (n = 45)	8 mg/kg (n = 80)
治療の状況, n (%)			
治療継続	27 (54)	22 (49)	19 (24)
治療中止 ^a	23 (46)	23 (51)	61 (76)
悪化 ^b	17 (34)	18 (40)	38 (48)
有害事象	2 (4)	3 (7)	12 (15)
相対用量強度の中央値, ^c %	99.7	98.6	93.9

Data cutoff: 4 September 2020.

^aOther reasons for discontinuation include withdrawal by patient, death, physician decision, and other.

^bProgression includes progressive disease per RECIST v1.1 and clinical progression.

^cRelative dose intensity (%) is calculated as $100 \times \text{actual total intensity} / \text{planned dose intensity}$, where planned dose intensity is the assigned dose level.
AE, adverse event; RECIST v1.1, Response Evaluation Criteria in Solid Tumors version 1.1.

TROPION-PanTumor01 : 安全性

- Dato-DXdは管理可能な安全性プロファイルを示した
 - グレード3以上のTEAEおよび重篤なTEAEは、4 mg/kgおよび6 mg/kgよりも8mg/kgで観察された

	Dato-DXdの用量		
	4 mg/kg (n = 50) n (%)	6 mg/kg (n = 45) n (%)	8 mg/kg (n = 80) n (%)
TEAE	48 (96)	41 (91)	79 (99)
グレード3以上	11 (22)	17 (38)	45 (56)
治療に関連したTEAE	43 (86)	35 (78)	76 (95)
グレード3以上	5 (10)	7 (16)	27 (34)
重篤なTEAE ^a	9 (18)	16 (36)	38 (48)
治療に関連	4 (8)	4 (9)	16 (20)
死亡に関連したTEAE ^b	4 (8)	1 (2)	7 (9)
治療に関連 ^c	1 (2)	0	2 (3)

Data cutoff: 4 September 2020.

^aA serious TEAE is any untoward medical occurrence that at any dose results in death, is life-threatening, requires inpatient hospitalization or prolongation of existing hospitalization, results in persistent or significant disability/incapacity, is a congenital anomaly/birth defect, or is an important medical event. ^bMost frequent (in ≥3 patients): respiratory failure/acute respiratory failure (n = 4): 2 at 4 mg/kg, 1 at 6 mg/kg, 1 at 8 mg/kg.

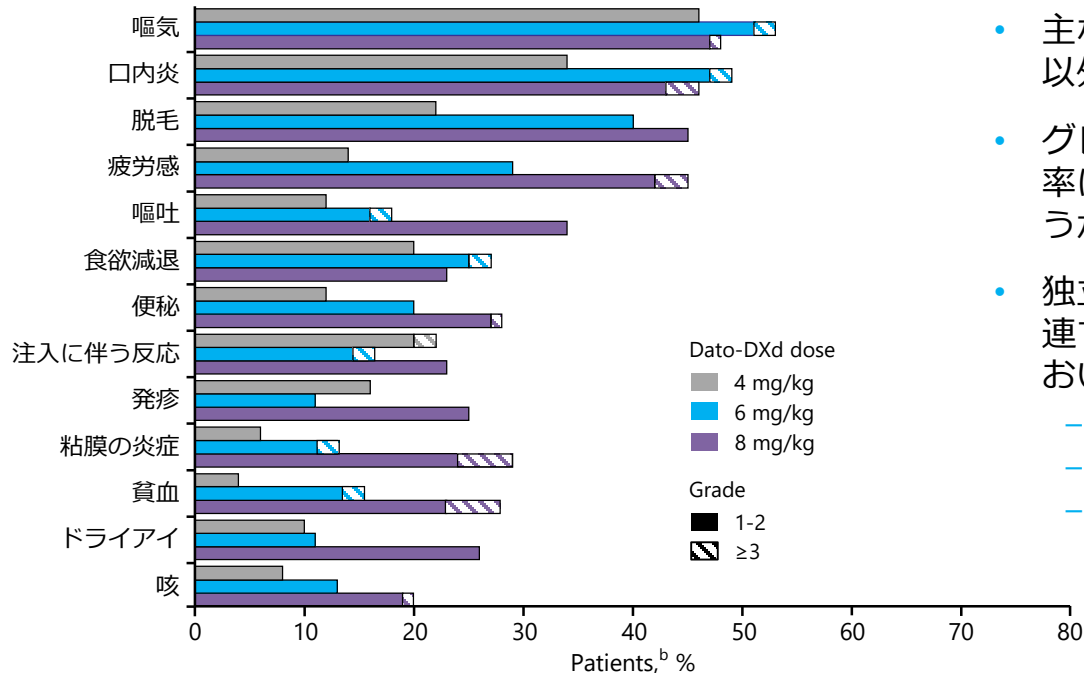
^cRespiratory failure: 1 at 4 mg/kg; pneumonitis: 2 at 8 mg/kg (with one patient having additional event of dyspnea).

TEAE, treatment-emergent adverse event.

◆ 安全性のプロファイルはこれまでに得られている結果と同様

治療中に発現した有害事象

15%以上の患者に発現したTEAEs^a



- 主な治療中に発現した有害事象は血液関連以外のものだった
- グレード3以上の口内炎と粘膜の炎症の発現率は4および6 mg/kgと比較して8mg/kgのほうが高かった^c
- 独立判定委員会により判定された治療に関連するILDは175人中14人の患者（8%）において発現^d
 - 4 mg/kg: 1人 (グレード3)
 - 6 mg/kg: 1人 (グレード2)
 - 8 mg/kg: 12人 (グレード1-2が8人; グレード3が1人; グレード5が3人)

Data cutoff: 4 September 2020.

Median duration of Dato-DXd exposure (months): 2.09 (0.7-20.0) for 4 mg/kg, 2.07 (0.7-19.7) for 6 mg/kg, 3.33 (0.7-13.5) for 8 mg/kg.

^aOut of 175 patients. ^bOut of 50, 45, and 80 patients treated with 4, 6, or 8 mg/kg, respectively.

^cGrade ≥3 stomatitis: 4 mg/kg, 0%; 6 mg/kg, 2%; 8 mg/kg, 3%. Grade ≥3 mucosal inflammation: 4 mg/kg, 0%; 6 mg/kg, 2%; 8 mg/kg, 5%.

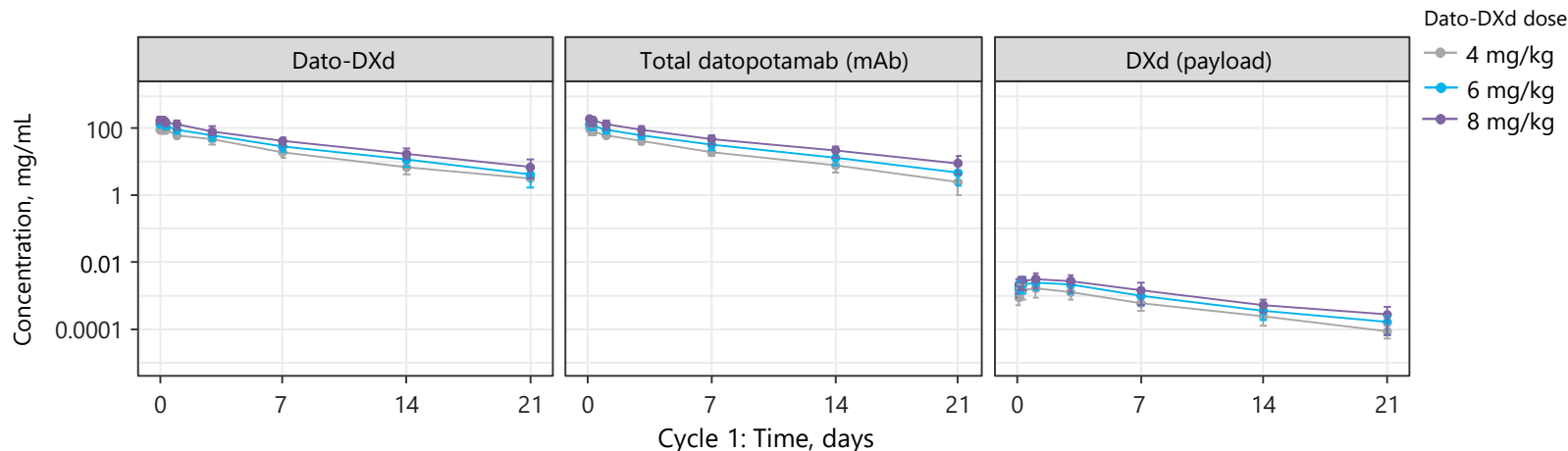
^dPotential ILD occurred on or before data cutoff. Adjudication could have occurred after data cutoff.

ILD, interstitial lung disease; TEAE, treatment-emergent adverse event.

◆ 安全性のプロファイルはこれまでに確認しているプロファイルと同様

TROPION-PanTumor01 : 薬物動態

- Dato-DXdのPKプロファイルは、用量に関係なく、3サイクルの治療を通じて一貫性を保持



- Dato-DXdの半減期は6mg/kgで4.6日であり、3週に1回投与を支持する結果となった
- すべての測定物質の曝露は、用量に比例して増加
- DXd（ペイロード）の全身曝露は、すべての用量で低かった（平均<0.01mg / mL）
- 総ダトポタマブモノクローナル抗体のPKプロファイルはADCのプロファイルと類似しており、リンカーの安定性が高いことを示唆

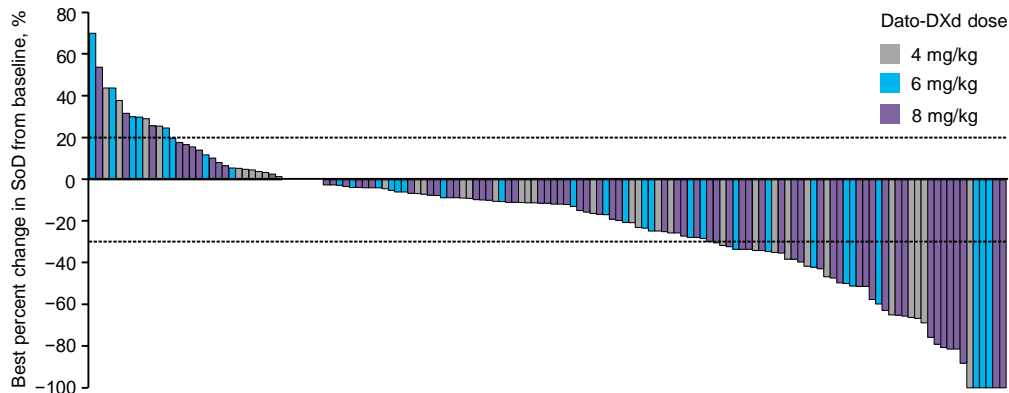
Data cutoff: 4 September 2020.

ADC, antibody drug conjugate; mAb, monoclonal antibody; PK, pharmacokinetics; Q3W, once every 3 weeks.

◆ ペイロードの全身曝露は低く、Dato-DXdの血中での安定性を確認

TROPION-PanTumor01 : 有効性

Best Change in Sum of Diameters and Overall Response (BICR)



Dato-DXd dose	Response-evaluable patients, ^a n	Confirmed CR/PR, ^b n	CR/PR (too early to be confirmed), ^b n	ORR, ^b % (n)	DCR, % (n)	PD, % (n)
4 mg/kg	40	7	2	23 (9)	73 (29)	15 (6)
6 mg/kg	39	6	2	21 (8)	67 (26)	21 (8)
8 mg/kg	80	19	1	25 (20)	80 (64)	9 (7)

Preliminary Progression-free Survival (BICR)^c

- PFS中央値 (95% CI)
 - 4 mg/kg: 4.3 months (2.0-NE), 6 mg/kg: 8.2 months (1.5-11.8), 8 mg/kg: 5.4 months (4.1-7.1)

Data cutoff: 4 September 2020.

^aIncludes patients with ≥1 postbaseline scan or who discontinued treatment.

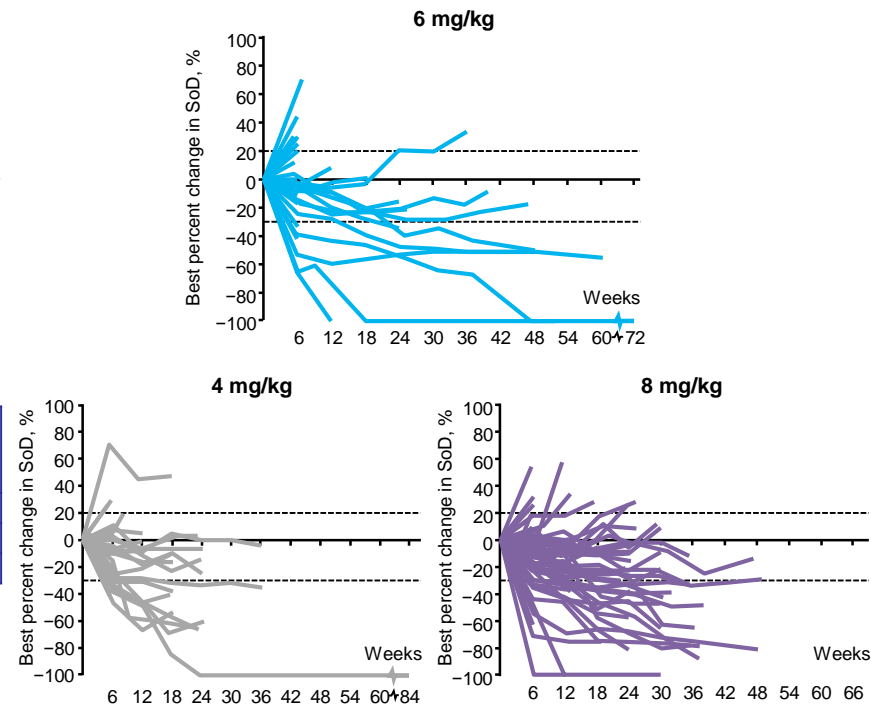
^bResponses are confirmed (CRs/PRs; n = 32) plus those CRs/PRs too early to be confirmed (n = 5).

^cPreliminary PFS limited by earlier censoring by data cutoff due to immature duration of follow-up for 4 and 6 mg/kg dose cohorts.

AE, adverse event; BICR, blinded independent central review; CI, confidence interval; CR, complete response; DCR, disease control rate;

NE, not evaluable; ORR, overall response rate; PFS, progression-free survival; PD, progressive disease; PR, partial response; SoD, sum of diameter.

Change in Sum of Diameters for Target Lesions (BICR)



◆ 4, 6, 8mg/kgで同様の奏効率と効果の持続性を確認

- 進行中のTROPION-PanTumor01 フェーズ1試験では、ダトポタマブ デルクステカン (Dato-DXd; DS-1062) は、複数の前治療歴のあるNSCLC患者において非常に有望な抗腫瘍活性と管理可能な安全性プロファイルを示した
 - 84%は免疫療法による治療歴があり、94%はプラチナベースの化学療法による治療歴があった
 - 4 mg/kgおよび6 mg/kgの用量が、8mg/kgよりも忍容性が高かった
 - 4mg/kg、6 mg/kgおよび8 mg/kg の用量すべてにおいて、盲検下独立中央判定によるORRは21%-25%であり、高いDCR (67%-80%)を確認

有望な有効性と安全性に基づき、Dato-DXd 6mg/kgを
免疫療法とプラチナベースの化学療法による治療歴のある進行性または転移性NSCLC患者を
対象としたフェーズ3 TROPION-Lung01試験 (NCT04656652) の用量として選択

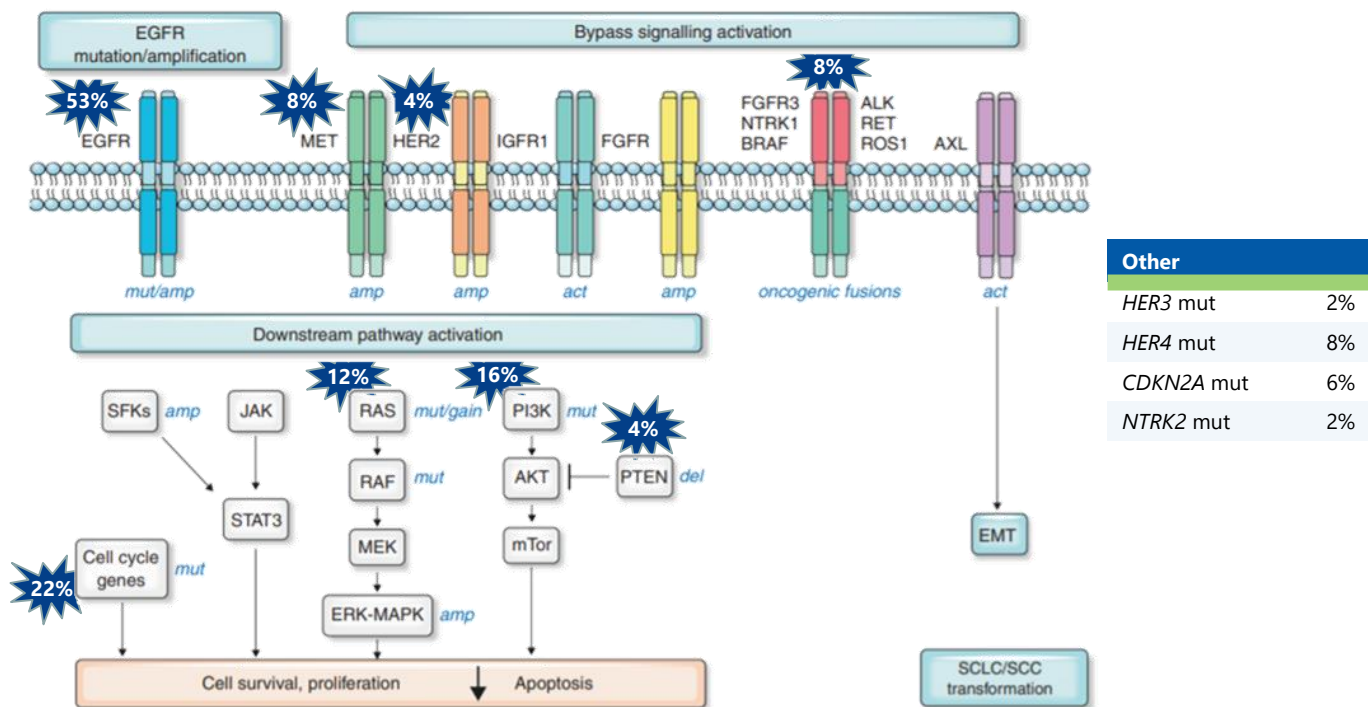
Data cutoff: 4 September 2020.

BICR, blinded independent central review; DCR, disease control rate; NSCLC, non-small cell lung cancer; ORR, overall response rate.

◆ フェーズ3試験の推奨用量は6 mg/kgを選択

HER3-DXd : NSCLC P1試験における遺伝子異常

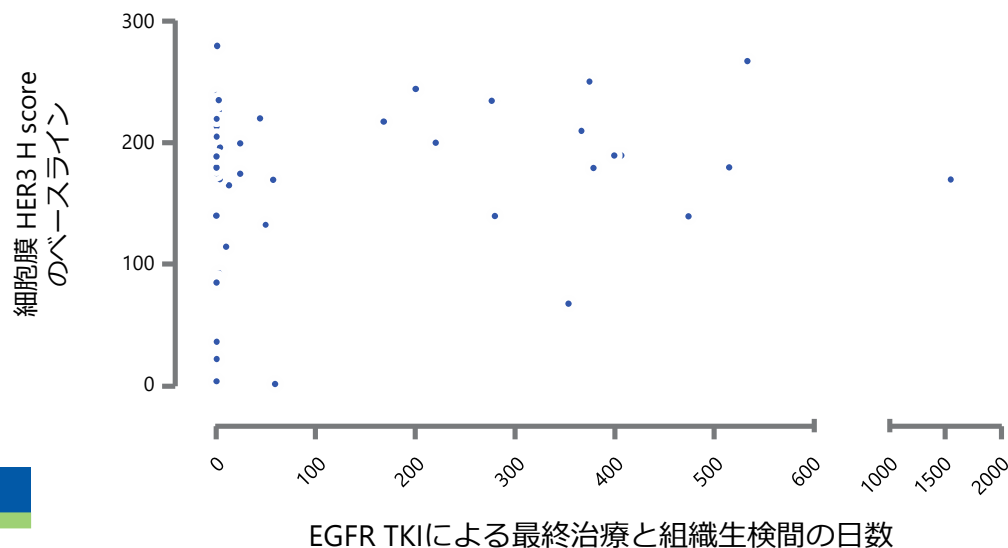
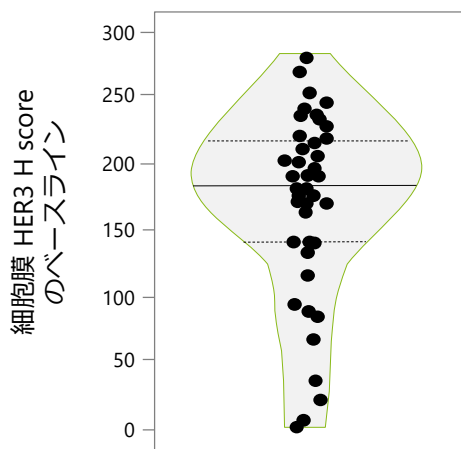
治療前の腫瘍組織およびctDNAにおけるEGFR TKI耐性のメカニズム (U31402-A-U102で示された割合)



Schematic representation of the known mechanisms of resistance to EGFR TKIs. Adapted from Leonetti A, Sharma S, Minari R, Perego P, Giovannetti E, Tiseo M. Resistance mechanisms to osimertinib in EGFR-mutated non-small cell lung cancer. *Br J Cancer*. 2019;121(9):725-737. This work is licensed under a Creative Commons Attribution 4.0 International (CC BY 4.0) License. <https://creativecommons.org/licenses/by/4.0/>.¹⁵ Percentages in blue highlight the mechanisms observed in the U31402-A-U102 study specimens (n = 49). EGFR mutations were retrieved from case report forms, OncoPrint™ Comprehensive Assay v3, GuardantOMNI™, and Biodesix. Mutations in the other genes were retrieved from OncoPrint™ Comprehensive Assay v3 and GuardantOMNI™. Detection cutoff was set at 0.1% for both GuardantOMNI™ and Biodesix. Act, activation; amp, amplification; ctDNA, circulating tumor DNA; del, deletion; EGFR, epidermal growth factor receptor; EMT, epithelial-mesenchymal transition; HER, human epidermal growth factor receptor; mut, mutation; SCC, squamous cell carcinoma; SCLC, small cell lung cancer; TKI, tyrosine kinase inhibitor.

◆ EGFR TKI治療後に各種遺伝子異常を有するNSCLC患者が試験に参加

ベースライン時の細胞膜上のHER3発現と直近のEGFR TKI治療後の経過時間との関連^{a,b}



全患者

評価可能な患者数 43

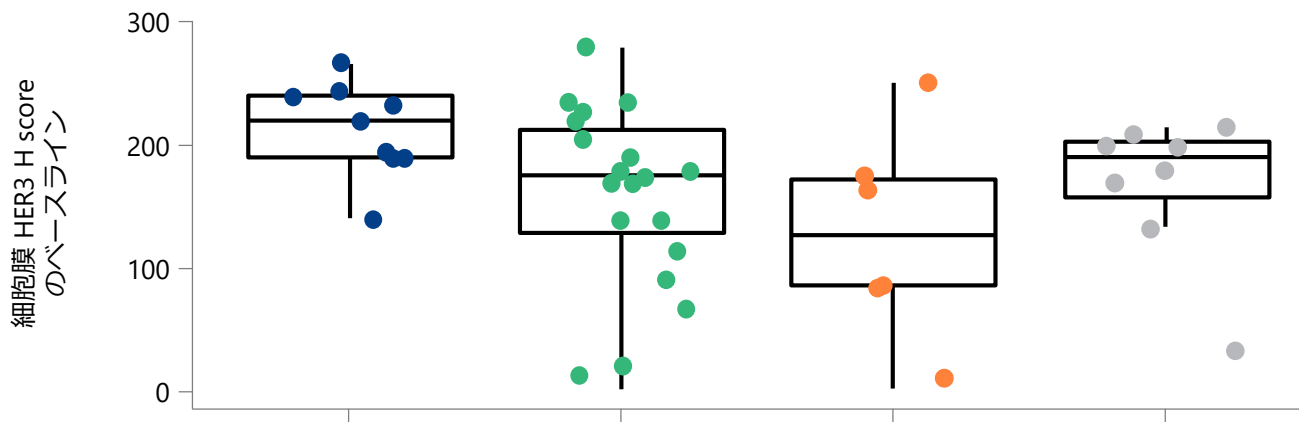
細胞膜HER3 H scoreの中央値 (range) 180 (2-280)

^aOne patient without evaluable postbaseline tumor assessments was included. ^bSolid horizontal bars in figure 3A denote medians; dotted horizontal lines are 25th and 75th percentiles.

EGFR, epidermal growth factor receptor; HER3, human epidermal growth factor receptor 3; TKI, tyrosine kinase inhibitor.

◆ 試験にエントリーした患者からの腫瘍サンプルのほぼ全てで、HER3の発現を確認

細胞膜 HER3 H Scoreと 盲検下独立中央判定による確認済み臨床効果との関連



cBOR (BICR)	CR/PR	SD	PD	NE
評価可能な患者数	9	19	6	8
細胞膜 HER3 H scoreの 中央値 (幅)	220 (140-268)	175 (4-280)	126.5 (2-251)	190 (36-215)

BICR, blinded independent central review; cBOR, confirmed best overall response; CR, complete response; HER3, human epidermal growth factor receptor 3; NE, not evaluable; PD, progressive disease; PR, partial response; SD, stable disease.

◆ 臨床効果とHER3発現が関連する傾向*

*進行中の試験からの部分的なデータにおいて

3 ADC アップデート

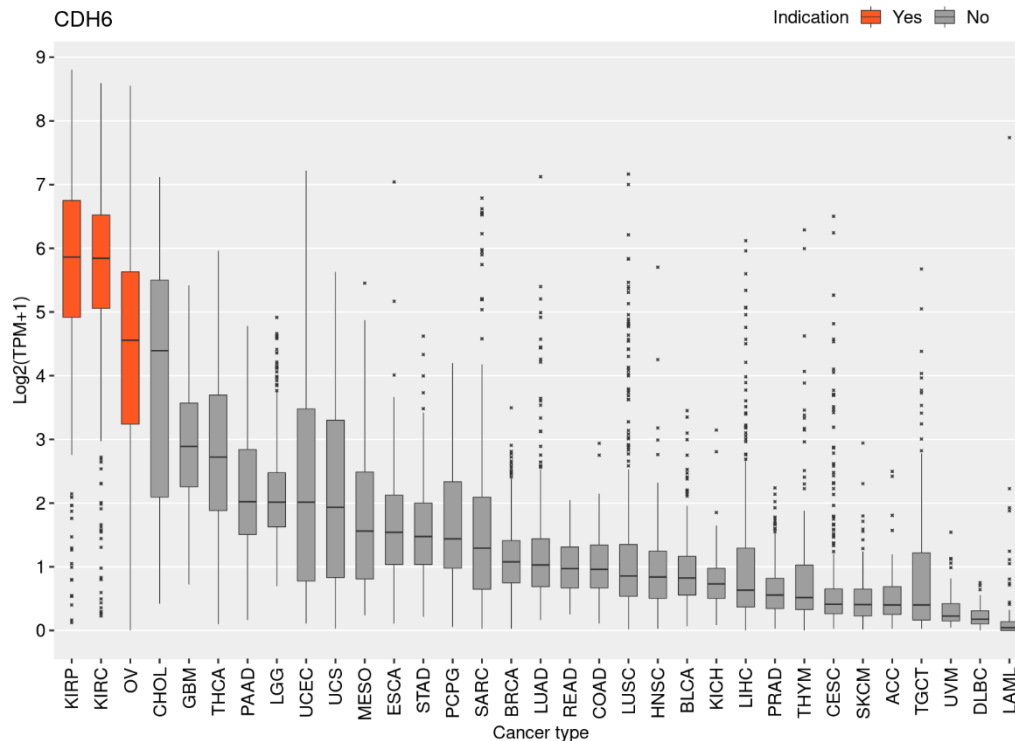
Alphaアップデート

今後のニュースフロー

DS-6000 : ターゲット抗原 CDH6

CDH6 (カドヘリン6)

- ◆ CDHファミリーに属する。機能は完全には未解明で、細胞間接着、上皮間葉転換 (EMT)、転移に関与していると考えられている
- ◆ 発生期では主に腎臓、子宮内膜、胎盤、中枢神経系で発現し、**成人の正常組織では最小限の発現**
- ◆ **腎細胞がんや卵巣がん**に多く発現すると言われている



ACC, 副腎皮質がん; **BLCA**, 膀胱尿路上皮がん; **BRCA**, 浸潤性乳がん;
CESC, 子宮頸部扁平上皮がんおよび子宮頸部腺がん;
CHOL, 胆管がん; **COAD**, 結腸腺がん;
DLBC, びまん性大細胞型B細胞リンパ腫; **ESCA**, 食道がん;
GBM, 多形性膠芽細胞腫; **HNSC**, 頭頸部扁平上皮がん;
KICH, 嫌色素性腎細胞がん; **KIRC**, **淡明細胞型腎細胞がん**;
KIRP, **乳頭状腎細胞がん**; **LAML**, 急性骨髄性白血病;
LGG, 脳低悪性度神経膠腫; **LIHC**, 肝細胞がん; **LUAD**, 肺腺がん;
LUSC, 肺扁平上皮がん; **MESO**, 中皮腫; **OV**, **卵巣漿液性嚢胞腺がん**;
PAAD, 膵臓腺がん; **PCPG**, 褐色細胞腫および傍神経節腫;
PRAD, 前立腺腺がん; **READ**, 直腸腺がん; **SARC**, 肉腫;
SKCM, 皮膚黒色腫; **STAD**, 胃腺がん; **TGCT**, 精巣胚細胞腫瘍;
THCA, 甲状腺がん; **THYM**, 胸腺腫;
UCEC, 子宮体がん(子宮内膜がん); **UCS**, 子宮がん肉腫;
UVM, ブドウ膜黒色腫

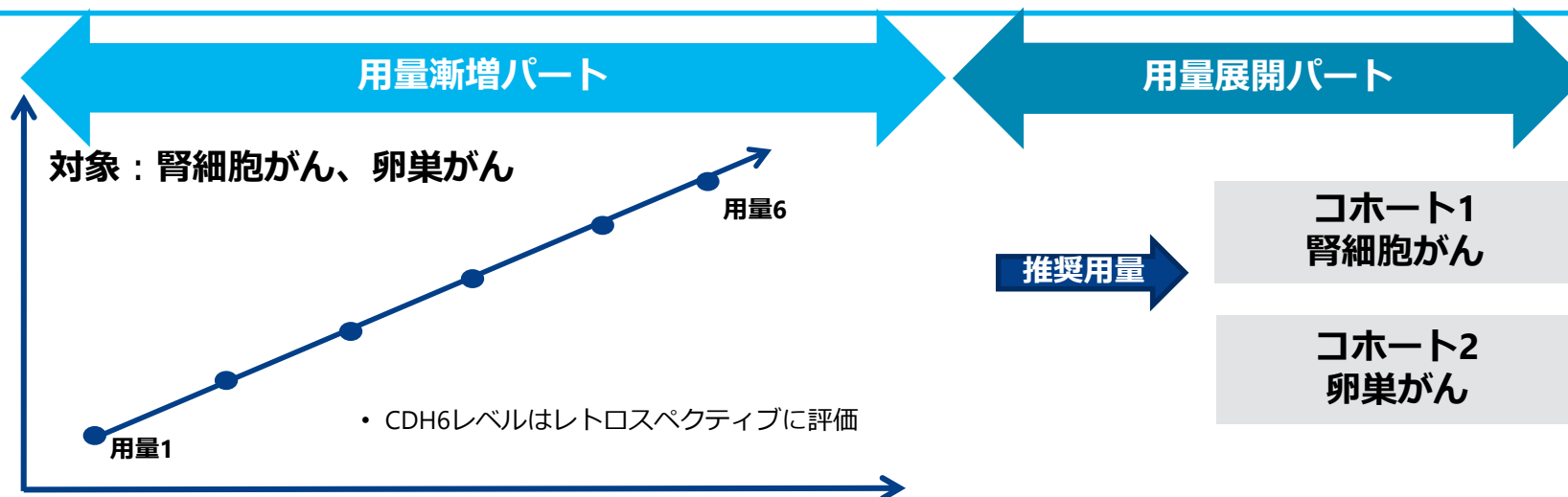
DS-6000 : がん種とフェーズ1試験デザイン

腎細胞がん

- ◆ **疾患概要** : 腎臓がんの約90%を占める腎実質細胞のがん
- ◆ **標準治療** : 1L; I/O + I/OまたはI/O + TKI、2L~; カボサンチニブ、VEGFR TKI等
- ◆ **推定患者数** : 166,000人 (日米欧5か国)*

卵巣がん

- ◆ **疾患概要** : 70%の卵巣がんは進行ステージで発見されることが多く、5年生存率に影響を与えている
- ◆ **標準治療** : 化学療法、化学療法 + ベバシズマブ、化学療法 + PARP阻害剤等
- ◆ **推定患者数** : 63,000人 (日米欧5か国)*



DS-1647 (G47Δ) : 悪性神経膠腫

◆ 2020年12月 : 日本にて承認申請

悪性神経膠腫

- ◆ **疾患概要** : 神経膠腫 (グリオーマ)は脳腫瘍の約1/4を占め、悪性度に従い4段階に分類
その中でも、悪性度の高いもの (グレード3、4)を悪性神経膠腫と呼ぶ
- ◆ **標準治療** : 手術による腫瘍摘出後、放射線治療+テモゾロミド
現時点では、**再発した神経膠腫に対する治療方法は確立していない**
- ◆ **推定患者数** : 悪性神経膠腫の罹患数は年間2,800人程度(日本)^{*1}

試験結果概要*2

- ◆ **主要評価項目** : 1年生存割合 92.3% (12/13例)
- ◆ **副次評価項目** : PFS中央値 8.6か月
- ◆ **安全性** : 管理可能な安全性プロファイル

次のステップ

- ◆ **承認** : **2021年度上期の承認見込み** (先駆け審査指定品目)
- ◆ **グローバル開発** : 未定

*1 The Committee of Brain Tumor Registry of Japan. Report of Brain Tumor Registry of Japan (2005-2008) 14th Edition. Neurol Med Chir (Tokyo). 2017;57(Supplement 1):9-102

*2 東京大学医科学研究所 藤堂具紀教授が実施した膠芽腫を対象としたフェーズ2 医師主導治験

◆ 2020年12年：脳領域の効能追加に係る承認事項一部変更承認申請

虚血性脳血管障害（非心原性脳梗塞等）

- ◆ **疾患概要**：虚血性脳血管障害のうち、アテローム血栓性脳梗塞・ラクナ梗塞に代表される非心原性脳梗塞は、主に動脈内に生じた血栓が原因となり起こる脳梗塞で、**再発リスクが高く、より高い再発予防効果を持つ薬剤が期待されている**
- ◆ **推定患者数**：アテローム血栓性脳梗塞患・ラクナ梗塞患者数は約140万人(日本)*

開発経緯

- ◆ 虚血性脳血管障害患者を対象に実施した検証試験においてクロピドグレルに対する非劣性は検証できなかったが、アテローム血栓性脳梗塞・ラクナ梗塞サブグループにて脳心血管系イベント発現の減少を確認
- ◆ **アテローム血栓性脳梗塞・ラクナ梗塞患者**を対象とし、新たに**フェーズ3試験**を実施。
- ◆ 本試験で**主要評価項目を達成**したことから、これまでの試験結果とともに、承認事項一部変更承認申請を実施

次のステップ

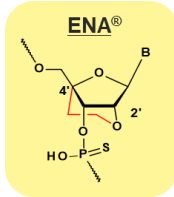
- ◆ **学会発表**：新たに実施したフェーズ3試験結果を2021年3月の日本脳卒中学会にて発表予定
- ◆ **承認**：2021年度第3四半期の承認見込み

DS-5141 : デュシェンヌ型筋ジストロフィー

◆ 2020年12月 : フェーズ1/2試験 (12週及び48週投与試験) の結果を入手

デュシェンヌ型筋ジストロフィー (Exon 45スキッピングにより治療可能な患者)

- ◆ **疾患概要** : ジストロフィン遺伝子の異常により、ジストロフィンタンパク質が産生されないことで発症する遺伝性筋疾患。徐々に筋力の低下が進行し、多くは20~30歳代で呼吸不全や心不全で死に至る
- ◆ **標準治療** : **これまでに承認されたExon 45スキッピング薬はない**
- ◆ **推定患者数** : Exon 45スキッピングにより治療可能な患者は約450人(日本)*



試験結果概要

- ◆ **安全性** : 安全性上の懸念は認められなかった
- ◆ **有効性** : ジストロフィン遺伝子のExon 45スキッピングにより得られるメッセンジャーRNAの産生を全ての患者で確認。ジストロフィンタンパク質の明らかな増加を複数の患者で確認し、詳細解析を実施中

次のステップ

- ◆ **学会発表** : 2021年度に実施予定
- ◆ **承認申請** : **詳細解析の結果をもとに、規制当局と協議する予定**

*宮武正太, 青木吉嗣, 武田伸一. デュシェンヌ型筋ジストロフィーに対するエクソンスキップ治療 有効性と安全性を併せもつモルフォリノ核酸の開発に向けて. 実験医学 2016; 34(19): 3151-8

Takeshima Y, Yagi M, Okizuka Y, et al. Mutation spectrum of the dystrophin gene in 442 Duchenne/Becker muscular dystrophy cases from one Japanese referral center. J Hum Genet. 2010;55(6):379-88.

◆ 2020年12月：フェーズ3試験の結果を入手

中枢性神経障害性疼痛

- ◆ **疾患概要**：中枢神経の損傷あるいはそれに伴う機能異常によって起こる痛みで、さまざまな知覚異常を伴う（例：脳卒中後疼痛、脊髄損傷後神経痛）
- ◆ **標準治療**： $\alpha_2\delta$ リガンド、オピオイド
- ◆ **推定患者数**： $\alpha_2\delta$ リガンドの治療対象となる患者は約21万人(日本)*

試験結果概要

- ◆ **安全性**：新たな安全性上の懸念は認められず
- ◆ **有効性**：平均疼痛スコア（痛みの強さを毎日測定した疼痛スコアの1週間の平均値）のベースラインから14週目までの変化量が、タリージェ投与群でプラセボ投与群に対して優越性を示した

次のステップ

- ◆ **学会発表**：2022年度の学会を予定
- ◆ **承認申請**：2021年度第1四半期を予定

3 ADC アップデート

Alphaアップデート

今後のニュースフロー

<p>エンハーツ®</p>	<p><u>フェーズ3 DESTINY-Breast02 : HER2陽性乳がん, 3L</u></p> <ul style="list-style-type: none"> 2021年度第2四半期 TLR入手見込み <p><u>フェーズ3 DESTINY-Breast03 : HER2陽性乳がん, 2L</u></p> <ul style="list-style-type: none"> 2021年度第2四半期 TLR入手見込み <p><u>フェーズ3 DESTINY-Breast04 : HER2低発現乳がん, 化学療法既治療</u></p> <ul style="list-style-type: none"> 2021年度第2四半期 TLR入手見込み <p><u>フェーズ2 DESTINY-Lung01 : HER2陽性/変異 NSCLC</u></p> <ul style="list-style-type: none"> 2021年度上期 TLR入手見込み
<p>Dato-DXd</p>	<p><u>フェーズ1 TROPION-Lung04 : NSCLC (actionable遺伝子変異なし、デュバルマブ併用)</u></p> <ul style="list-style-type: none"> 2020年度第4四半期 開始予定
<p>HER3-DXd</p>	<p>フェーズ2 申請用 HERTHERNA-Lung01 : EGFR変異NSCLC</p> <ul style="list-style-type: none"> 2020年度第4四半期 開始予定
<p>G47Δ</p>	<p>悪性神経膠腫</p> <ul style="list-style-type: none"> 日本 : <u>2021年度上期 承認見込み</u>
<p>DS-3201</p>	<p><u>フェーズ2 申請用 : 末梢性T細胞リンパ腫</u></p> <ul style="list-style-type: none"> 2021年度第1四半期 開始予定
<p>DS-6000</p>	<p><u>FIHフェーズ1 : 腎細胞がん、卵巣がん</u></p> <ul style="list-style-type: none"> 2020年度第4四半期 開始予定
<p>リクシアナ®</p>	<p><u>超高齢者心房細動</u></p> <ul style="list-style-type: none"> 日本 : <u>2021年度上期 承認見込み</u>
<p>タリージェ®</p>	<p><u>中枢性神経障害性疼痛</u></p> <ul style="list-style-type: none"> 日本 : <u>2021年度第1四半期 承認申請予定</u>

① 2020年度 第3四半期 連結決算

② ビジネスアップデート

③ 研究開発アップデート

④ **Appendix**



2020年度の主要マイルストーン(3 ADC)

2021年1月現在



プロジェクト	目標適応 [フェーズ, 試験名]	FY2020				FY2021	
		Q1	Q2	Q3	Q4	H1	
エンハーツ	乳がん	HER2+, 3L [P2申請用, DESTINY-Breast01]	欧 申請		欧 CHMP 肯定見解	欧 承認	
		HER2+, 3L [P3, DESTINY-Breast02]					TLR入手見込
		HER2+, 2L [P3, DESTINY-Breast03]					TLR入手見込
		HER2 low, 化学療法既治療 [P3, DESTINY-Breast04]					TLR入手見込
		HER2+, ポストネオアジュバント [P3, DESTINY-Breast05]			試験開始		
		HER2 low, 化学療法未治療 [P3, DESTINY-Breast06]		試験開始			
		HER2+, 3L~併用 [P1/2, DESTINY-Breast07]				試験開始	
		HER2 low, 3L 併用 [P1, DESTINY-Breast08]				試験開始	
	胃がん	TNBC, デュルバルマブ併用 [P1b/2, BEGONIA]	試験開始				
		HER2+, 3L [P2申請用, DESTINY-Gastric01]	日 申請	日 承認	米 申請受理	米 承認(2L)	
		HER2+, 2L~/1L [P1b/2, DESTINY-Gastric03]	試験開始				
		HER2+, 2L [P3, DESTINY-Gastric04]					試験開始予定
	NSCLC	デュルバルマブ併用 [P2, HUDSON]	試験開始				
		HER2変異 [P2, DESTINY-Lung02]					試験開始予定
		HER2+, 1L [P1b, DESTINY-Lung03]					試験開始予定
	その他	乳がん/NSCLC, ペムブロリズマブ併用 [P1]	試験開始				
HER2変異がん [P2, DESTINY-PanTumor01]						試験開始	
HER2発現がん [P2, DESTINY-PanTumor02]			試験開始				
Dato-DXd	NSCLC, actionable遺伝子変異なし [P3, TROPION-Lung01]					試験開始予定	
	NSCLC, actionable遺伝子変異なし, ペムブロリズマブ併用 [P1, TROPION-Lung02]			試験開始			
	NSCLC, actionable遺伝子変異なし, デュルバルマブ併用 [P1, TROPION-Lung04]					試験開始予定	
	NSCLC, actionable遺伝子変異あり [P2, TROPION-Lung05]					試験開始予定	
HER3-DXd	EGFR変異NSCLC [P2申請用, HERTHENA-Lung01]					試験開始予定	
	EGFR変異NSCLC, オシメルチニブ併用 [P1]					試験開始予定	
	CRC [P2]		試験開始				

赤字下線：FY2020 Q2からの追加またはアップデート

CRC：大腸がん, NSCLC：非小細胞肺がん, TNBC：トリプルネガティブ乳がん

2020年度の主要マイルストーン(Alpha)

2021年1月現在



プロジェクト	目標適応 [フェーズ, 試験名, 地域]	FY2020				FY2021 H1
		Q1	Q2	Q3	Q4	
ベキシダルチニブ	腱滑膜巨細胞腫 [P3, ENLIVEN, 欧]	CHMP否定 見解				
	腱滑膜巨細胞腫 [P2, 日]				試験開始予定	
G47Δ	悪性神経膠腫 [IIS, 日]			申請		承認見込
イエスカルタ	再発性又は難治性B細胞リンパ腫 [P2申請用, 日]				承認	
DS-3201	末梢性T細胞リンパ腫 [P2申請用, 日米亜]					試験開始予定
DS-6157	消化管間質腫瘍 (GIST) [P1, 日米]	試験開始				
DS-1055	固形がん [P1, 日米]			試験開始		
DS-6000	腎細胞がん、卵巣がん [P1, 米]				試験開始予定	
リクシアナ	超高齢者心房細動 [P3, ELDERCARE-AF, 日]	TLR入手	申請			承認見込
エフィエント	虚血性脳血管障害 [P3, PRASTRO III, 日]	TLR入手		申請		
タリージェ	中枢性神経障害性疼痛 [P3, 日]			TLR入手		申請予定
DS-5141	デュシェンヌ型筋ジストロフィー [P1/2, 日]			TLR入手		
DS-5670	COVID-19予防ワクチン [日]				試験開始予定	
DS-2319	COVID-19 [日]				試験開始予定	

赤字下線 : FY2020 Q2からの追加またはアップデート




IIS : 医師主導治験 TLR: Top Line Results

主要研究開発パイプライン : 3 ADC


2021年1月現在



フェーズ1		フェーズ2	フェーズ3	申請中
(日米) NSCLC, TNBC TROPION-PanTumor01	(米欧亜) HER2+ BC 2L~/1L DESTINY-Breast07	(米欧亜) TNBC(テールバールマ併用) BEGONIA	(日米欧亜)HER2+ BC 3L DESTINY-Breast02	
(日米) NSCLC(actionable遺伝子変異なし, ハンドリスマ併用) TROPION-Lung02	(米欧亜) HER2低発現 BC 化学療法未治療/化学療法既治療 DESTINY-Breast08	(米欧) HER2+ GC 2L DESTINY-Gastric02	(日米欧亜) HER2+ BC 2L DESTINY-Breast03	
(日米) NSCLC(actionable遺伝子変異なし, テールバールマ併用) TROPION-Lung04	(米欧亜) HER2+ GC 併用, 2L~/1L DESTINY-Gastric03	(日米欧)HER2+/変異NSCLC DESTINY-Lung01	(日米欧亜) HER2低発現 BC 化学療法既治療 DESTINY-Breast04	
(日米欧亜) NSCLC	(欧亜)HER2+ NSCLC (テールバールマ併用) DESTINY-Lung03	(日米欧)HER2+/変異NSCLC DESTINY-Lung02	(日米欧亜) HER2+ BC ホストネオアジバロント DESTINY-Breast05	
(日米)EGFR変異NSCLC (オムチン併用)	(米欧) BC, 膀胱がん (ニホルマ併用)	(米欧亜) NSCLC(テールバールマ併用) HUDSON	(日米欧亜) HER2低発現 BC 化学療法未治療 DESTINY-Breast06	
(日米) HER3+ BC	(米欧) BC, NSCLC (ハンドリスマ併用)	(日米欧) HER2+ CRC DESTINY-CRC01	(日米欧亜) HER2+ GC 2L DESTINY-Gastric04	
		(米欧亜) HER2変異がん DESTINY-PanTumor01	(日米欧亜) NSCLC(actionable遺伝子変異なし) TROPION-Lung01	
		(米欧亜) HER2発現がん DESTINY-PanTumor02		
		(日米欧亜) NSCLC (actionable遺伝子変異あり) TROPION-Lung05		
		(日米) EGFR変異NSCLC HERTHENA-Lung01		
		(日米欧) HER3+大腸がん		

-  エンハーツ® 抗HER2 ADC
-  Dato-DXd 抗TROP2 ADC
-  HER3-DXd 抗HER3 ADC

BC : 乳がん, CRC : 大腸がん, GC : 胃がん, NSCLC : 非小細胞肺がん, TNBC : トリプルネガティブ乳がん

 : ブレークスルーセラピー指定(米)

主要研究開発パイプライン : Alpha

2021年1月現在



フェーズ1		フェーズ2	フェーズ3	申請中
DS-7300 (日米) 抗B7-H3 ADC 固形がん	DS-3201 (日米) EZH1/2阻害剤 非ホジキンリンパ腫	DS-3201 (日米) EZH1/2阻害剤 ATL/L	キザルチニブ (日米欧亜) FLT3阻害剤 1L AML QuANTUM-First	G47Δ (日) がん治療用HSV-1 悪性神経腫瘍 IIS
DS-6157 (日米) 抗GPR20 ADC GIST	DS-3201 (米) EZH1/2阻害剤 AML, ALL	DS-3201 (日米欧亜) EZH1/2阻害剤 PTCL	ペキシダルチニブ (日亜) CSF-1/KIT/FLT3阻害剤 腱滑膜巨細胞腫	リクシアナ (日) FXa阻害剤 超高齢者心房細動
DS-6000 (米) 抗CDH6 ADC 腎細胞がん、卵巣がん	PLX2853 (米) BET阻害剤 AML	DS-1001 (日) 変異型IDH1阻害剤 神経腫瘍	タリージェ (日亜) α ₂ δリガンド 中枢性神経障害性疼痛	エフィエント (日) ADP 受容体阻害剤 虚血性脳血管障害
DS-1055 (日米) 抗GARP抗体 固形がん	PLX2853 (米) BET阻害剤 固形がん	DS-5141 (日) ENAオリゴヌクレオチド DMD	ミネプロ (日) ミネラルコルチコイド受容体ブロッカー 糖尿病性腎症	VN-0107/MEDI3250 (日) 鼻腔噴霧インフルエンザ 弱毒生ワクチン
DS-2741 (日) 抗Orai1抗体 アトピー性皮膚炎	PLX2853 (米) BET阻害剤 婦人科腫瘍、卵巣がん	DS-1211 (米) TNAP阻害剤 弾性線維性仮性黄色腫	VN-0102/JVC-001 (日) 麻しんおたふくかぜ風しん混合ワクチン	
	PLX2853 (米) BET阻害剤 前立腺がん			

オンコロジー

スペシャルティ・メディスン

ワクチン

ALL : 急性リンパ性白血病, AML : 急性骨髄性白血病, ATL/L : 成人T細胞白血病/リンパ腫, DMD : デュシェンヌ型筋ジストロフィー, GIST : 消化管間質腫瘍, IIS : 医師主導治験, NSCLC : 非小細胞肺癌, PTCL : 末梢性T細胞リンパ腫

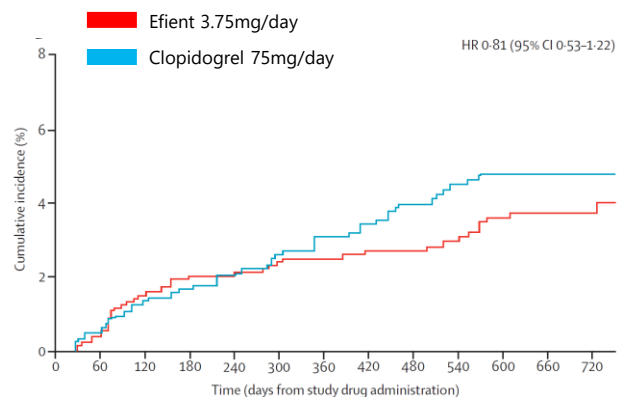
□ : オンコロジー領域のプロジェクトで、フェーズ2試験の結果をもって承認申請予定のもの

: 先駆け審査指定 (日本) 希少疾病用医薬品指定 (日米欧) されたもの

エフィエント® : 虚血性脳血管障害

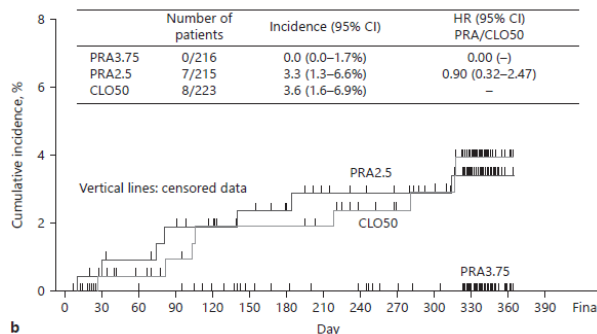
PRASTRO-I

- ◆ 虚血性脳血管障害患者 : 3,747例
- ◆ アテローム・ラクナ梗塞サブグループ (2,275例)にて19%の脳心血管系イベント発現率の減少
- ◆ 問題となる出血*の増加なし



PRASTRO-II

- ◆ 虚血性脳血管障害患者 (高齢・低体重) : 654例
- ◆ エフィエント3.75mg群で脳心血管系イベントは発現しなかった (0.0%)
- ◆ 問題となる出血*の増加なし



PRASTRO-III

- ◆ アテローム血栓性脳梗塞及びラクナ梗塞患者 : 234例
- ◆ エフィエント3.75mg群で脳心血管系イベント発現率はクロピドグレル群に対して低いことが示された
- ◆ 新たな安全性上の懸念なし

(詳細は学会にて報告予定)

Lancet Neurol 2019; 18: 238-47

Cerebrovasc Dis 2020;49:152-159

*頭蓋内出血、大出血等

承認申請

略語	英語	意味
AE	Adverse event	医薬品が投与された際に起こる、あらゆる好ましくない、あるいは意図しない徴候（臨床検査値の異常を含む）、症状、または病気のことであり、当該医薬品との因果関係の有無は問わない
BICR	Blinded independent central review	盲検下独立中央判定
BTD	Breakthrough therapy designation	画期的治療薬指定
CR	Complete response	完全奏効（がんが完全に消えること）
DCR	Disease control rate	病勢コントロール率（病状をコントロールできている患者の割合）
DLT	Dose limiting toxicity	用量制限毒性（増量ができない理由となる毒性）
DOR	Duration of response	奏効期間（効果が持続する期間）
EGFR	Epidermal growth factor receptor	上皮成長因子受容体
ILD	Interstitial lung disease	間質性肺臓炎
MTD	Maximum tolerated dose	最大耐用量（許容できない副作用を引き起こすことなく投与できる最大の用量）
ORR	Overall response rate Objective response rate	全奏効率（治療効果のあった患者さんの割合、CRとPRの合計で表す）
OS	Overall survival	全生存期間（治療開始から亡くなるまでの期間）
PD	Progress disease	病勢進行（治療にも関わらず治療前よりも病状が悪化すること）
PFS	Progression-free survival	無増悪生存期間（がんが進行することなく生存している期間）
PR	Partial response	部分奏効（がんの大きさが30%以上縮小し、それが4週間続いた状態）
SD	Stable disease	治療の前後でがんの大きさがほぼ変わっていない状態
TEAE	Treatment emergent adverse event	試験治療前には存在しておらず試験治療期間に出現した事象、または試験治療前の状態に比べて悪化した事象

本資料に関するお問い合わせ先

第一三共株式会社
コーポレートコミュニケーション部

TEL: 03-6225-1125 (株式市場関係者の皆様)

03-6225-1126 (報道関係者の皆様)

Email: DaiichiSankyoIR@daiichisankyo.co.jp