

## 開発品の進捗状況

## 1. 国内開発品状況

## &lt;承認取得開発品&gt;

製品名／開発コード	区分	効能／薬理作用	剤型	
グラクティブ錠 <sup>※1</sup> (ONO-5435) /MK-0431	効能追加	2型糖尿病（インスリン製剤との併用療法） ／D P P - 4 阻害作用	錠	共同 (米メルク社)
プロイメンド点滴静注用 <sup>※2</sup> (ONO-7847) /MK-0517	新有効成分	抗悪性腫瘍剤投与に伴う悪心・嘔吐 ／ニューロキニン 1 受容体拮抗作用	注射	導入 (米メルク社)

平成 24 年 3 月期第 1 四半期決算発表（8 月 2 日）時点からの変更点

※1:2 型糖尿病治療剤「グラクティブ錠（ONO-5435）/MK-0431」は、平成 23 年 9 月 16 日付でインスリン製剤との併用療法に関する効能追加の製造販売承認を取得しました。

※2: 抗悪性腫瘍剤投与に伴う悪心・嘔吐の治療剤「プロイメンド点滴静注用（ONO-7847）/MK-0517」は、平成 23 年 9 月 26 日付で製造販売承認を取得しました。

## &lt;申請中開発品&gt;

製品名／製品名候補 ／開発コード	区分	予定効能／薬理作用	剤型	
イメンドカプセル <sup>※3</sup> (ONO-7436) /MK-0869	小児での効能 追加	抗悪性腫瘍剤投与に伴う悪心・嘔吐／ニューロ キニン 1 受容体拮抗作用	カプセル	導入 (米メルク社)

平成 24 年 3 月期第 1 四半期決算発表（8 月 2 日）時点からの変更点

※3:抗悪性腫瘍剤投与に伴う悪心・嘔吐の治療剤「イメンドカプセル（ONO-7436）/MK-0869」は、小児での効能追加の製造販売承認を申請しました。

## &lt;臨床試験中開発品&gt;

製品名／製品名候補 ／開発コード／一般名	区分	予定効能／薬理作用	フェーズ <sup>a</sup>	剤型	
グラクティブ錠 <sup>※4</sup> (ONO-5435) /MK-0431	効能追加	2型糖尿病（速効型インスリン分泌促進薬との併用療法）／D P P - 4 阻害作用	Ⅲ	錠	共同 (米メルク社)
ONO-4164SC <sup>※5</sup> /BMS-188667SC	剤型追加	関節リウマチ／T 細胞活性化抑制作用	Ⅲ	注射	共同 (グリストル・マイアーズ スクイブ社)
注射用オノアクト (ONO-1101)	効能追加	心機能低下例における頻脈性不整脈 ／ $\beta_1$ 遮断作用(短時間作用型)	Ⅱ/Ⅲ	注射	自社
ONO-7165 <sup>※6</sup> /EMD531444	新有効成分	非小細胞肺癌／腫瘍抗原 MUC-1 由来 ペプチドワクチン	Ⅱ	注射	共同 (独メルク社)
ONO-4641	新有効成分	多発性硬化症／S 1 P 受容体作動作用	Ⅱ	錠	自社
ONO-3849 /Methylnaltrexone bromide	新有効成分	オピオイド鎮痛薬の使用に伴う難治性 便秘／ $\mu$ オピオイド受容体拮抗作用	Ⅱ	注射	導入 (プロジェックス社)
ONO-7643 /RC-1291	新有効成分	がん悪液質／グレリン様作用	Ⅱ	錠	導入 (ヘルシン社)
ONO-2745 /CNS 7056	新有効成分	全身麻酔／G A B A <sub>A</sub> 受容体作動作用 (短時間作用型)	Ⅱ	注射	導入 (パイオン社)
オパルモン錠 (OP-1206)	効能追加	手根管症候群／血管拡張作用	Ⅱ	錠	共同 (大日本住友製薬)
ONO-4538 <sup>※7</sup> /BMS-936558	新有効成分	悪性黒色腫／完全ヒト型抗PD-1抗 体	Ⅱ	注射	自社
ONO-7057 /Carfilzomib	新有効成分	多発性骨髄腫／プロテアソーム阻害作 用	I / Ⅱ	注射	導入 (オニキス社)
ONO-5334	新有効成分	骨粗鬆症／カテプシンK阻害作用	I	錠	自社

ONO-3951 /Asimadoline	新有効成分	過敏性腸症候群／ $\kappa$ オピオイド受容体 作動作用	I	錠	導入 (タイオガ社)
ONO-6950	新有効成分	気管支喘息／ロイコトリエン受容体拮 抗作用	I	錠	自社

平成24年3月期第1四半期決算発表（8月2日）時点からの変更点

※4:2型糖尿病治療剤「グラクティブ錠（ONO-5435）/MK-0431」は、速効型インスリン分泌促進薬との併用療法での効能追加を目的としたフェーズIII試験を開始しました。

※5:関節リウマチ治療薬「ONO-4164SC/ BMS-188667SC」は、ブリストル・マイヤーズ スクイブ社との提携契約に基づき、共同開発することになりました。

※6:非小細胞肺癌を対象としたフェーズII試験を実施中の「ONO-7165/EMD531444」は、独メルク社とのライセンス契約に基づき、共同開発することになりました。

※7:完全ヒト型抗PD-1抗体であるONO-4538/BMS-936558は、悪性黒色腫を対象としたフェーズII試験を開始しました。

## 2. 国外開発品状況

### < 臨床試験中開発品 >

製品名／製品名候補 ／開発コード	区分	予定効能／薬理作用	フェーズ	剤型	
ONO-5334	新有効成分	骨粗鬆症／カテプシンK阻害作用	II	錠	自社
ONO-4641	新有効成分	多発性硬化症／S1P受容体作動作用	II	錠	導出 (独メルク社)
ONO-4538 / BMS-936558	新有効成分	腎細胞がん／完全ヒト型抗PD-1 抗体	II	注射	導出 (ブリストル・マイヤーズ スクイブ社)
ONO-4538 / BMS-936558	新有効成分	C型肝炎／完全ヒト型抗PD-1抗体	I	注射	導出 (ブリストル・マイヤーズ スクイブ社)
ONO-7746	新有効成分	血小板減少症／トロンボポエチン受容 体作動作用	I	カプセル	導入 (日産化学工業)
ONO-6950	新有効成分	気管支喘息／ロイコトリエン受容体 拮抗作用	I	錠	自社
ONO-2952	新有効成分	過敏性腸症候群／TSPO(トランスロ ケータープロテイン)拮抗作用	I	錠	自社
ONO-4053	新有効成分	アレルギー性鼻炎／プロスタグラン ディンD2受容体拮抗作用	I	錠	自社

## 主な開発品

### ONO-4164SC/BMS-188667SC 注射剤

ONO-4164SC は、オレンシアの皮下投与製剤で、関節リウマチを対象として開発を進めております。本剤はT細胞を活性化するシグナルを阻害することでサイトカインの分泌を抑制し、関節の炎症を鎮静化します。なお、オレンシアの静脈内投与製剤は既存治療で効果不十分な関節リウマチを対象に上市されております。

国内：関節リウマチ フェーズⅢ（ブリストル・マイヤーズ スクイブ社と共同開発）

海外：関節リウマチ 承認取得（ブリストル・マイヤーズ スクイブ社）

### ONO-7165/EMD531444 注射剤

ONO-7165 は、リポソームワクチンで、非小細胞肺癌を対象として開発を進めております。本剤は腫瘍抗原であるMUC-1を標的とするがん免疫療法薬で、この腫瘍抗原を免疫細胞が認識して、腫瘍細胞を攻撃すると考えられております。

国内：非小細胞肺癌 フェーズⅡ（独メルク社と共同開発）

海外：非小細胞肺癌 フェーズⅢ（独メルク社）

### ONO-4641 錠剤

ONO-4641 はS1P(スフィンゴシン-1-リン酸)受容体作動薬で、多発性硬化症を対象として開発を進めています。本剤は血中のリンパ球をリンパ節にとどめ、血中のリンパ球数を減少させる作用を持つ低分子化合物であり、その結果として病巣へのリンパ球浸潤を抑制することで、難病とされる多発性硬化症などの自己免疫疾患の画期的な治療薬になるものと期待しております。

国内：多発性硬化症 フェーズⅡ（日米欧三極での国際共同治験）

海外（米国、欧州）：多発性硬化症 フェーズⅡ（日米欧三極での国際共同治験）

### ONO-3849/Methylnaltrexone bromide 注射剤

ONO-3849 は末梢の $\mu$ オピオイド受容体拮抗薬で、オピオイド鎮痛薬の使用に伴う難治性便秘を対象に開発を進めています。オピオイド鎮痛薬は癌性疼痛に対して主に使用されているのですが、副作用として難治性の便秘を伴います。本剤はオピオイド鎮痛薬の鎮痛効果に影響を及ぼすことなく、オピオイド鎮痛薬の使用に伴う難治性の便秘を改善する薬剤です。

国内：オピオイド鎮痛薬の使用に伴う難治性便秘 フェーズⅡ

海外：発売中（プロジェニックス社）

### ONO-7643/RC-1291 錠剤

ONO-7643 は低分子のグレリン様作用薬で、がん悪液質を対象として開発を進めています。本剤は食欲増進や筋肉増強などの生理作用を有するホルモンであるグレリンと同様の作用を持つ低分子化合物であり、癌の進行に伴い食欲不振、体脂肪量や筋肉量の低下を特徴とする全身消耗状態（がん悪液質）にある患者さんのQOLを改善する画期的な薬剤になるものと期待しております。

国内：がん悪液質 フェーズⅡ

海外（米国など）：がん悪液質 フェーズⅢ（ヘルシン社）

#### ONO-2745/CNS 7056 注射剤

本剤は GABA<sub>A</sub> 受容体作動作用を有する短時間作用型全身麻酔薬で、全身麻酔時の導入及び維持、ならびに集中治療における人工呼吸管理中の鎮静剤として開発を進めております。本剤はエステラーゼと呼ばれる酵素によって速やかに代謝され、薬剤投与終了後速やかに鎮静効果が消失することから、調節性や安全性に優れた薬剤になるものと期待しています。

国内：全身麻酔 フェーズⅡ

海外（米国）：フェーズⅡ（パイオン社）

#### ONO-4538/BMS-936558 注射剤

ONO-4538 は完全ヒト型抗 PD-1 抗体で、癌などを対象として開発を進めています。PD-1 は、リンパ球の表面にある受容体の一種で、生体において活性化したリンパ球を沈静化させるシステム（負のシグナル）に関与しています。癌細胞は、このシステムを利用して免疫反応から逃れているという研究成績が報告されています。ONO-4538 は、リンパ球を沈静化させる PD-1 の働きを抑制することで、癌細胞やウイルスを異物と認識してこれを排除する免疫反応を増進するものと期待しております。

国内：悪性黒色腫 フェーズⅡ

海外（米国など）：腎細胞がん フェーズⅡ（ブリストル・マイヤーズ スクイブ社と共同開発）

海外（米国）：C型肝炎 フェーズⅠ（ブリストル・マイヤーズ スクイブ社と共同開発）

#### ONO-7057/Carfilzomib 注射剤

ONO-7057 はプロテアソーム阻害剤で、多発性骨髄腫を対象として開発を進めています。血液細胞の1つである形質細胞のがんであり、予後不良とされる多発性骨髄腫の新たな治療選択肢になるものと期待しております。

国内：多発性骨髄腫 フェーズⅠ／Ⅱ

海外：多発性骨髄腫 フェーズⅢ、米国は迅速承認申請中（オニキス社）

#### ONO-5334 錠剤

ONO-5334 はカテプシン K 阻害剤で、骨粗鬆症を対象として開発を進めています。ビスホスホネート製剤と異なり、骨形成に影響を及ぼさず、骨吸収のみを抑制する新しい作用メカニズムの骨粗鬆症治療剤です。

国内：骨粗鬆症 フェーズⅠ

海外（欧州）：骨粗鬆症 フェーズⅡ

#### ONO-3951/Asimadoline 錠剤

ONO-3951 は  $\kappa$  オピオイド受容体作動薬で、過敏性腸症候群を対象に開発を進めています。3種類あるオピオイド受容体（ $\mu$ 、 $\kappa$ 、 $\delta$ ）のうち、消化管の痛みや運動に関与しているといわれる  $\kappa$  受容体に選択的に作用し、腹痛をはじめとする種々の腹部症状を改善する薬剤です。

国内：過敏性腸症候群 フェーズⅠ

海外（米国）：過敏性腸症候群 フェーズⅢ（タイオガ社）

#### ONO-6950 錠剤

ONO-6950 はロイコトリエン受容体拮抗薬で、気管支喘息を対象に開発を進めています。気道炎症を抑制することにより、気管支喘息患者さんの症状改善が期待されます。

国内：気管支喘息 フェーズⅠ

海外（米国）：気管支喘息 フェーズⅠ

ONO-7746 カプセル (日産化学工業株式会社より導入)

ONO-7746 は体内において血小板の産生を促進する造血因子であるトロンボポエチンの受容体を活性化することにより血小板を増加させる経口投与が可能な低分子化合物で、血小板減少を伴う種々疾患の出血リスクの軽減や血小板輸血に伴う感染リスクを克服する薬剤として開発できるものと期待しています。なお、日産化学工業は原薬の開発・製造を担うなど、共同して開発を進めています。

海外 (米国) : 血小板減少症 フェーズ I

ONO-2952 錠剤

ONO-2952 は主に中枢においてニューロステロイドの産生に関与する TSPO (トランスロケータープロテイン) 拮抗薬で、過敏性腸症候群を対象に開発を進めています。ストレスが腸腸相関の異常を引き起こすメカニズムを遮断することで、過敏性腸症候群の諸症状を改善することが期待されます。

海外 (米国) : 過敏性腸症候群 フェーズ I

ONO-4053 錠剤

ONO-4053 はプロスタグランジンD2 受容体拮抗薬で、アレルギー性鼻炎を対象に開発を進めています。鼻閉、くしゃみ、鼻汁といったアレルギー性鼻炎の3主徴のなかで、特に鼻閉に対する改善効果が期待されます。

海外 (欧州) : アレルギー性鼻炎 フェーズ I

イメンドカプセル (ONO-7436) /MK-0869

国内 : 抗悪性腫瘍剤投与に伴う悪心・嘔吐 申請中 (小児での効能追加)

グラクティブ錠 (ONO-5435) /MK-0431

国内 : 2型糖尿病 (速効型インスリン分泌促進剤との併用療法) フェーズIII (効能追加) (米メルク社と共同開発)

注射用オノアクト (ONO-1101)

国内 : 心機能低下例における頻脈性不整脈 フェーズII/III

オパールモン錠 (OP-1206)

国内 : 手根管症候群 フェーズII (大日本住友製薬株式会社と共同開発)