



臨床開発の現状

執行役員 研究開発本部長
西畑 利明



研究開発本部のビジョンと戦略

研究開発本部ビジョン

医療上の未充足ニーズを満たし、患者さんのQOL向上に貢献する薬剤・サービスの継続的提供の実現

研究開発ビジョン達成のための戦略

1. 医療上の未充足ニーズの動向および競合会社の研究開発動向を把握した上で参天製薬（株）が強みを発揮できるように資源を集中し、成果に結びつける
2. 参天の強い領域である眼科領域医療用医薬品開発（自社創薬・共同創薬・化合物導入）に資源を集中し、新製品（薬剤）パイプラインの継続的充足と新製品の治療上での優位性を 訴求・提案（サービス）を実現する
3. RA・OA領域については、参天の強みが発揮できる自社創薬スタイルに特化しつつ創出した新規化合物を共同開発（国内）・ライセンスアウト（海外）を基本的な開発路線とする。また、必要に応じて、共同研究・開発については公的資金の活用も含めた経済的に効率性の可能性を追及する方法を立案し、実施する
4. 迅速な研究開発活動を実現することで、競争優位を達成する



パイプライン一覧表 -緑内障領域-

一般名 (開発番号)	効能	分類/作用機序	自社/導入	開発段階
タフルプロスト (DE-085)	緑内障 高眼圧症	プロスタノイドFP受容体 作動薬 ぶどう膜強膜流出促進	自社 (旭硝子と共同)	日本: P3 欧米: P3
オルメサルタン (DE-092)	緑内障 高眼圧症	アンジオテンシン IIAT1 受容体拮抗薬 ぶどう膜強膜流出促進	導入 (三共)	日本: P2 欧米: P2準備中
塩酸ロメリジン (DE-090)	緑内障	カルシウム拮抗薬 眼循環改善	導入 (日本オルガノン)	日本: P2

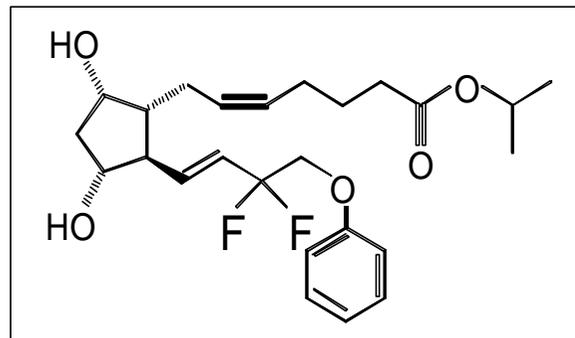


DE-085

一般名： タフルプロスト

効能効果： 緑内障、高眼圧症

上市予定： 2007-8年



(現在、フェーズ3臨床試験段階)

開発形態： 旭硝子(株) / 参天製薬(株) 共同開発

分類： プロスタノイドFP受容体作動薬

作用機序： FP受容体の活性化を介し、ぶどう膜強膜流出路からの房水流出を促進する

特長： 強力な眼圧下降作用を有し、さらに付加価値として正常眼圧緑内障においても眼圧下降作用を示し得る副作用の少ない室温保存可能な水性点眼剤



DE-085 -ヒトプロスタノイドFP受容体親和性-

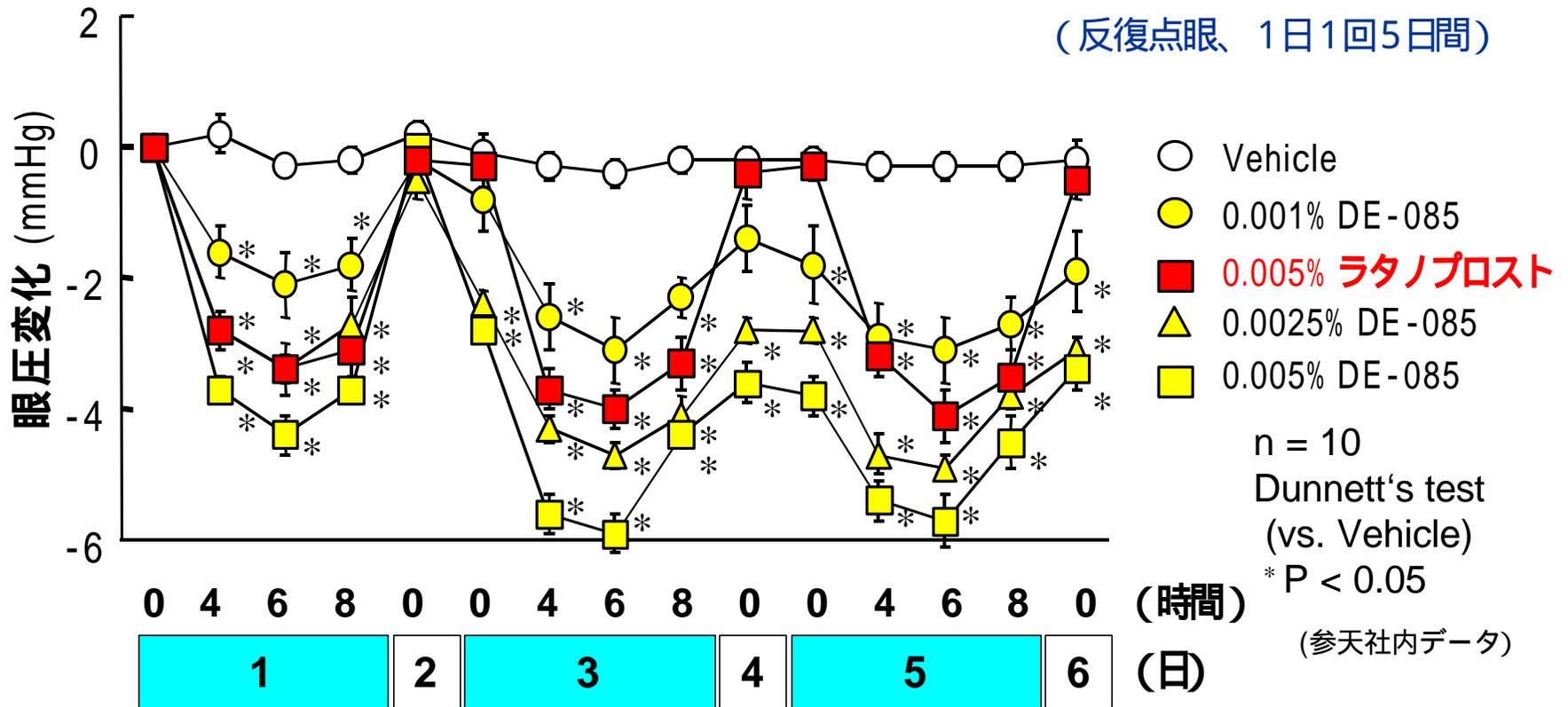
化合物 (脱エステル体)	K_i (nM)	比 (DE-085=1)
DE-085	0.40	1
ラタノプロスト	4.7	12

(参天社内データ)

**DE-085はプロスタノイドFP受容体に
ラタノプロストより高い親和性を示した**



DE-085 - 非臨床試験(正常眼圧モデル)における眼圧下降作用-

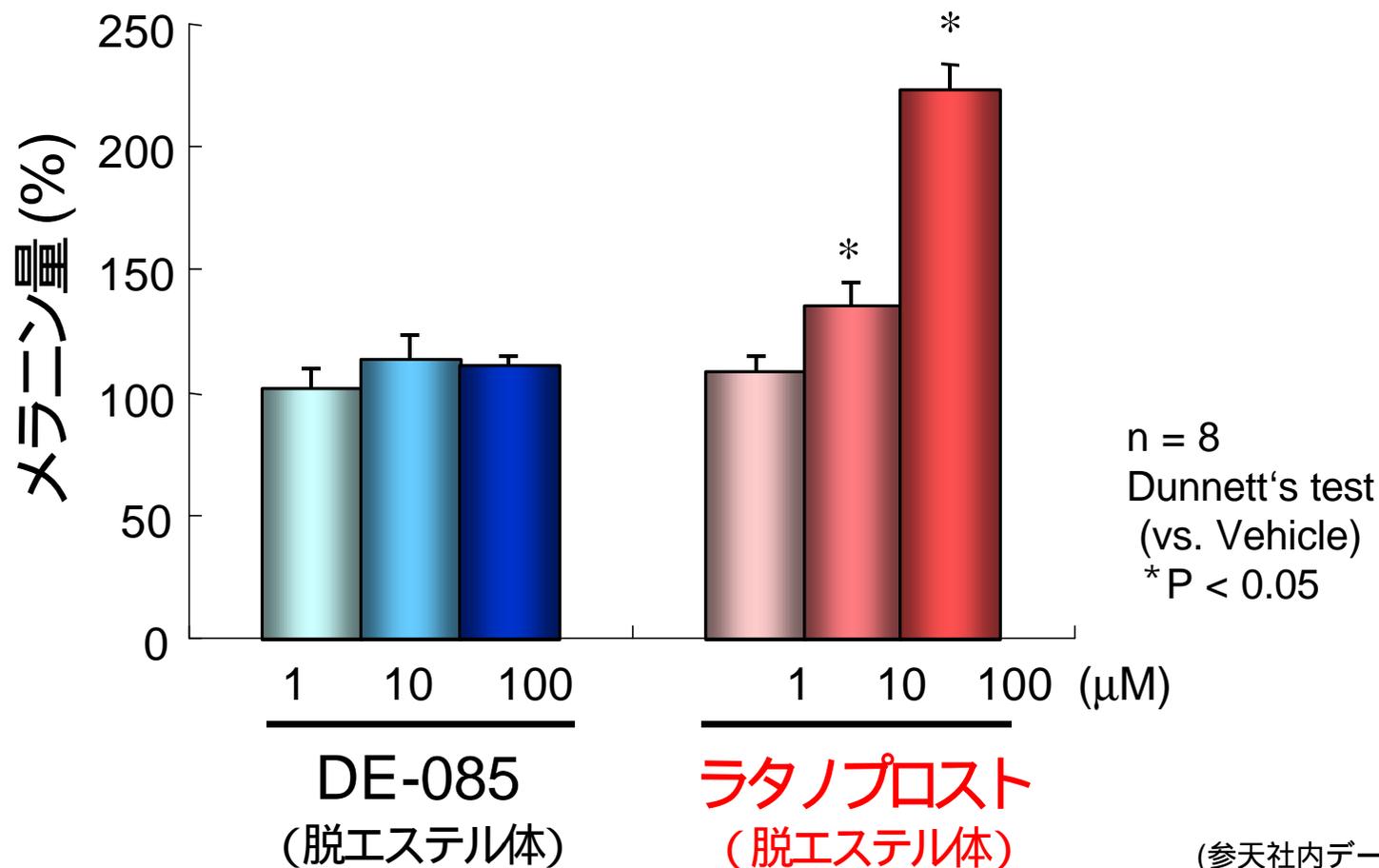


- DE-085は眼圧を経日的に濃度依存的に下降させた
- DE-085の眼圧下降作用は点眼3日目まで増強され、それ以降安定した
- ラタノプロストが作用を示さないトラフ時にも、DE-085は有意な眼圧下降作用を示した



DE-085 -In vitroメラニン産生促進作用-

(培養B16メラノーマ細胞、化合物96時間処置)



ラタノプロストはメラニン産生促進作用を示したが、
DE-085は示さなかった

一般名: オルメサルタン

効能効果: 緑内障、高眼圧症

上市予定: 2007-8年

(現在、フェーズ2臨床試験段階)

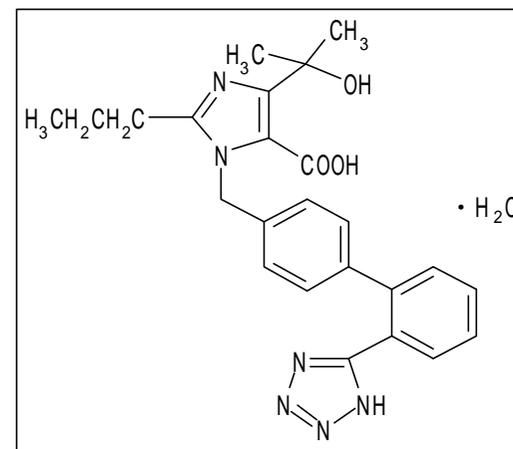
導入元: 三共

分類: アンジオテンシンII AT1受容体拮抗薬

作用機序: AT1受容体拮抗作用により、ぶどう膜強膜流出路からの房水流出を促進する

特長: これまでになかった新しい作用機序

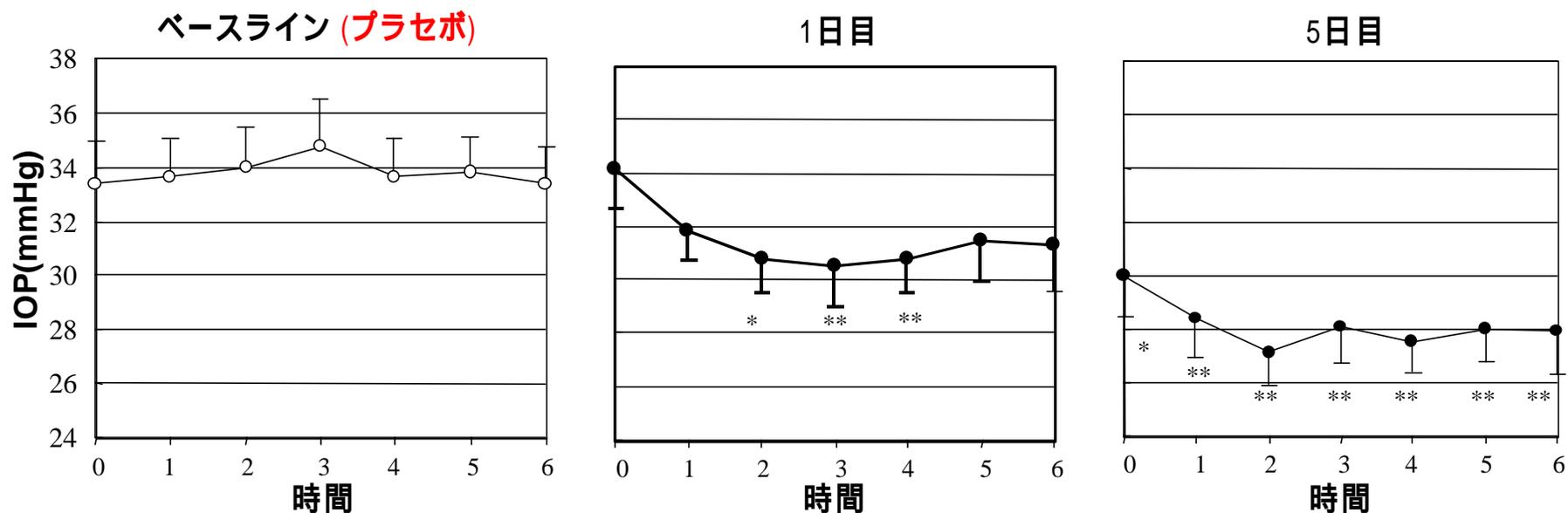
遮断剤・PG製剤に匹敵する薬効と少ない副作用および眼血流改善作用に期待





DE-092 -非臨床試験(高眼圧モデル)における眼圧下降作用-

(4% DE-092点眼液 反復点眼 1日2回5日間)



平均値 ± S.E.

* p<0.05, ** p<0.01, 同時刻のプラセボとの比較 (paired t-test)

(参天社内データ)

DE-092は高眼圧モデルにおいて有意な眼圧下降作用を示した



パイプライン一覧表 -炎症・角膜・感染症領域-

一般名 (開発番号/製品名)	効能	分類/作用機序	自社/導入	開発段階
レボフロキサシン 点眼液1.5% (アイイクス)	細菌性 角膜潰瘍	DNAジャイレーズ阻害剤 抗菌作用	導入 (第一)	米国：承認
シクロスポリン (DE-076)	春季カタル	カルシニューリン阻害剤 免疫抑制	導入 (ノバルティス)	日本：申請中
レボフロキサシン + プレトニゾロン (DE-094)	感染による 角膜炎	ニューキノロン剤+ ステロイド合剤 抗菌 + 抗炎症作用	導入 (第一)	米国：P2
diquafosol tetrasodium (DE-089)	ドライアイ	P2Y ₂ 受容体作動薬 涙液分泌の促進	導入 (インスパイア)	日本：P2
ヒアルロン酸 ナトリウム (ヒアレイン)	ドライアイ	生体高分子細胞保護剤 保水および角膜創傷治 癒促進	自社	米国：P2準備中 (日本：販売中)
ゲファルナート (DE-099)	ドライアイを 伴う角結膜 上皮障害	粘膜保護剤 ムチン分泌促進	自社	日本：臨床準備中



パイプライン一覧表 -骨・関節領域-

一般名 (開発番号/製品名)	効能	分類/作用機序	自社/導入	開発段階
一般名未定 (DE-096)	関節リウマチ	TNF 抑制剤 TNF 産生阻害作用	自社	日本:P1
一般名未定 (DE-098)	関節リウマチ	抗APO-1抗体 滑膜細胞等アポトーシス 誘導作用	導入 (セントゴア)	日本:臨床準備中
ブシラミン (リマチル)	変形性関節症	疾患修飾剤(DMOAD) 軟骨保護・水腫改善作用	自社	日本:臨床準備中



パイプライン一覧表 -前回発表時(2003/11/5)との相違点-

一般名 (開発番号/製品名)	効能	地域	開発段階
レボフロキサシン 点眼液1.5% (アイクイクス)	細菌性角膜潰瘍	米国	申請中 承認
タフルプロスト (DE-085)	緑内障・高眼圧症	日本・欧米	P2 P3
オルメサルタン (DE-092)	緑内障・高眼圧症	欧米	P2 準備中
ゲファルナート (DE-099)	ドライアイなどを伴う 角結膜上皮障害	日本	臨床準備中