

Passion for Innovation.  
Compassion for Patients.™



# 2021年度 第2四半期 決算説明会

**第一三共株式会社**

**代表取締役社長 兼 CEO  
真鍋 淳**

**2021年 10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。

# 本日本話しする内容

① 2021年度 第2四半期 連結決算

② 2021年度 業績予想

③ ビジネスアップデート

④ 研究開発アップデート

⑤ Appendix



# 連結業績の概要

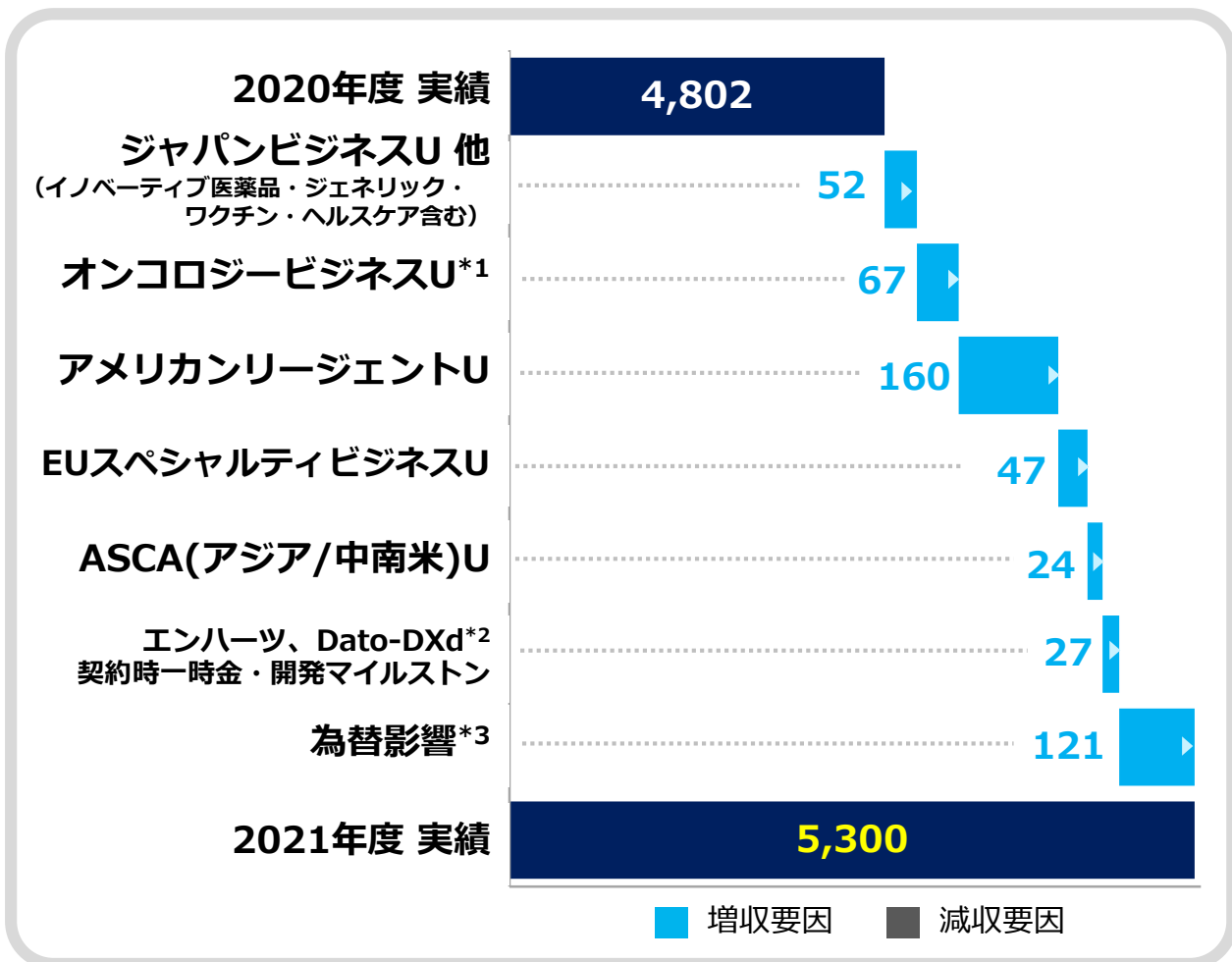
(単位：億円)

	2020年度 第2四半期累計実績	2021年度 第2四半期累計実績	増減額	
売上収益	4,802	5,300	+10.4% 498	
売上原価*	1,686	1,726	40	
販売費・一般管理費*	1,486	1,657	171	
研究開発費*	1,046	1,090	44	
コア営業利益*	584	827	+41.7% 243	
一過性の収益*	1	21	20	
一過性の費用*	0	1	0	
営業利益	585	847	+44.9% 263	
税引前利益	670	860	190	
当期利益（親会社帰属）	517	625	+20.9% 108	
為替 レート	USD/円	106.92	109.80	+2.88
	EUR/円	121.29	130.89	+9.60

\* 当社は、経常的な収益性を示す指標として、営業利益から一過性の収益・費用を除外したコア営業利益を開示しています。  
一過性の収益・費用には、固定資産売却損益、事業再編に伴う損益（開発品や上市製品の売却損益を除く）、有形固定資産、無形資産、のれんに係る減損損失、損害賠償や和解等に伴う損益の他、非経常的かつ多額の損益が含まれます。  
本表では売上原価、販売費・一般管理費、研究開発費について、一過性の収益・費用を除く実績を示しています。  
営業利益からコア営業利益への調整表は、決算補足資料に記載しています。

## 498億円増収 (為替影響除き実質377億円増収)

(単位：億円)

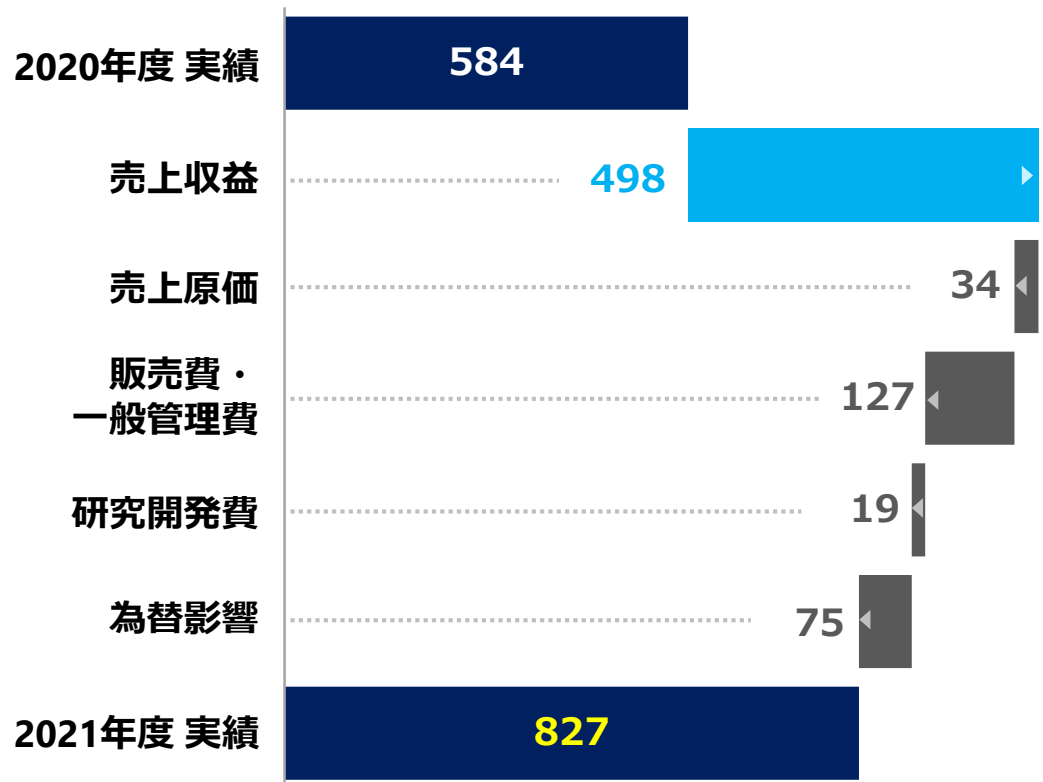


増収		減収	
<b>ジャパンビジネス ユニット他</b>			
リクシアナ	+66	メモリー	-110
タリージェ	+50		
エンハーツ	+34		
第一三共エスファ エゼチミブAG、メマンチンAG等	+56	ワクチン事業 インフルエンザワクチン	-53
第一三共ヘルスケア ロキソニン類	+8		
<b>オンコロジービジネス ユニット*1</b>			
エンハーツ	+104	オルメサルタン	-27
<b>アメリカンリージェント ユニット</b>			
インジェクタファー	+72		
GE注射剤	+60		
<b>EUスペシャルティビジネス ユニット</b>			
リクシアナ	+86	長期収載品譲渡益	-33
<b>エンハーツ、Dato-DXd*2契約時一時金・開発マイルストーン</b>			
Dato-DXd契約時一時金	+20		

\*1 第一三共Inc. (米国) の売上収益と第一三共ヨーロッパのがん領域事業の売上収益  
 \*2 Dato-DXd: ダトポタマブ デルクステカン (DS-1062)  
 \*3 為替影響の内訳 USD: +29億円、EUR: +49億円、アジア/中南米: +43億円

## 243億円増益 (為替影響除き実質197億円増益)

(単位：億円)



売上収益 ..... +498

為替影響 +121を含む

売上原価 ..... +34 (利益減)

プロダクトミックスの変化に伴う原価率改善

販売費・ ..... +127 (利益減)

一般管理費

エンハーツに係るアストラゼネカとのプロフィット・シェアの増加による費用増

研究開発費 ..... +19 (利益減)

3ADC\*の研究開発投資の増加

為替影響 ..... +75 (利益減)

売上原価 ..... +6

販売費・一般管理費 ..... +44

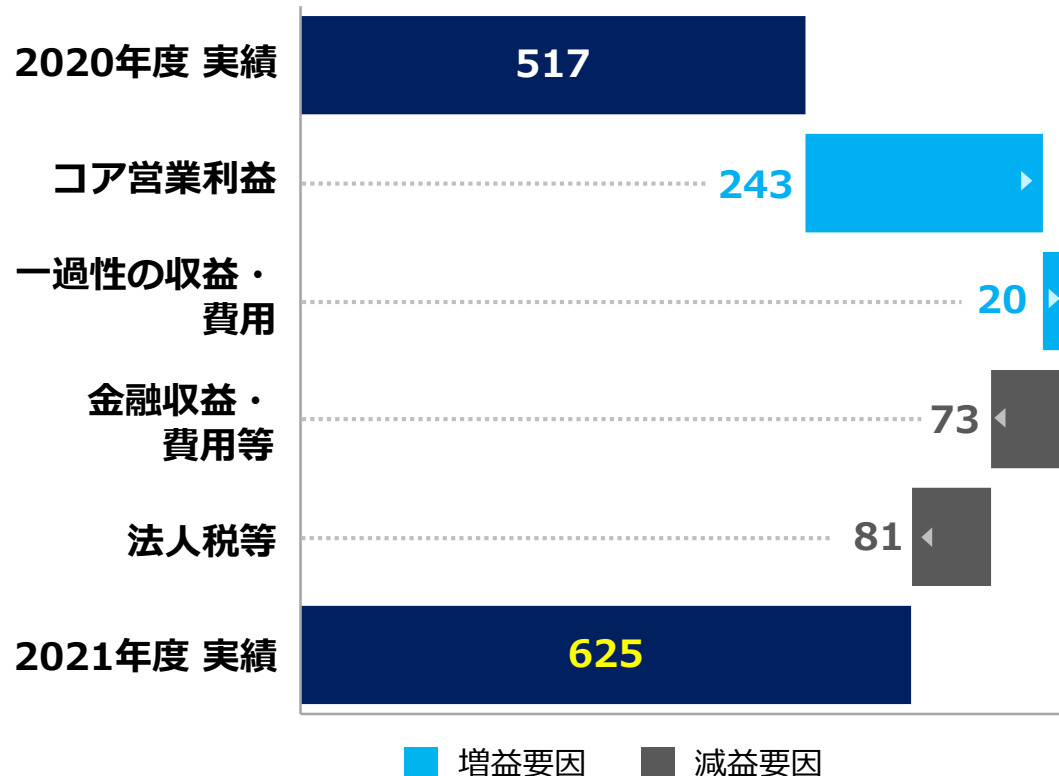
研究開発費 ..... +25

■ 増益要因 ■ 減益要因

\*3ADC：①エンハーツ、トラスツズマブ 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)

# 当期利益（親会社帰属）増減

## 108億円 増益



(単位：億円)

一過性の収益・費用 ..... -20 (利益増)

2021年度：大阪物流センター譲渡益 ..... -21

金融収益・費用等 ..... +73 (利益減)

- 2020年度：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 ..... +47
- 為替差損益の悪化 ..... +11

法人税等 ..... +81 (利益減)

	2020年度 第2四半期累計実績	2021年度 第2四半期累計実績	増減額
税引前利益	670	860	+190
法人税等	154	235	+81
税率	23.0%	27.3%	+4.4%

# 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）

	2020年度 第2四半期累計実績	2021年度 第2四半期累計実績	増減額
ジャパンビジネス	2,501	2,556	+55
第一三共ヘルスケア	330	338	+8
オンコロジービジネス	235	310	+75
エンハーツ	113	224	+110
TURALIO	8	13	+5
アメリカンリージェント	589	770	+180
インジェクタファー	210	289	+80
ヴェノファー	146	165	+19
GE注射剤	198	265	+67
EUスペシャルティビジネス	543	637	+93
リクシアナ	350	471	+121
Nilemdo/Nustendi	-	16	+16
オルメサルタン	110	103	-7
ASCA（アジア/中南米）	484	551	+67

為替	USD/円	106.92	109.80	+2.88
レート	EUR/円	121.29	130.89	+9.60



# 国内主要製品 売上収益増減

(単位：億円)

		2020年度 第2四半期累計実績	2021年度 第2四半期累計実績	増減額
リクシアナ	抗凝固剤	383	448	+66
ネキシウム	抗潰瘍剤	390	396	+7
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	170	184	+15
タリージェ	疼痛治療剤	91	142	+50
テネリア	2型糖尿病治療剤	124	121	-4
ランマーク	がん骨転移による骨病変治療剤	97	101	+4
ロキソニン	消炎鎮痛剤	123	113	-10
ビムパット	抗てんかん剤	71	89	+17
カナリア	2型糖尿病治療剤	77	84	+7
エフィエント	抗血小板剤	72	80	+9
エンハーツ	抗悪性腫瘍剤 (抗HER2抗体薬物複合体)	10	44	+34
レザルタス	高血圧症治療剤	68	62	-5
イナビル	抗インフルエンザウイルス剤	13	9	-5

# 本日本話する内容

① 2021年度 第2四半期 連結決算

**② 2021年度 業績予想**

③ ビジネスアップデート

④ 研究開発アップデート

⑤ Appendix



# 業績予想の修正

(単位：億円)

	2021年度 予想 (4月公表)	2021年度 予想 (10月公表)	差異	
<b>売上収益</b>	<b>9,900</b>	<b>10,300</b>	<b>+400</b>	
売上原価*	3,200	3,300	+100	
販売費・一般管理費*	3,340	3,480	+140	
研究開発費*	2,660	2,620	-40	
<b>コア営業利益*</b>	<b>700</b>	<b>900</b>	<b>+200</b>	
一過性の収益*	-	20	+20	
一過性の費用*	-	-	-	
<b>営業利益</b>	<b>700</b>	<b>920</b>	<b>+220</b>	
<b>税引前利益</b>	<b>700</b>	<b>920</b>	<b>+220</b>	
<b>当期利益 (親会社帰属)</b>	<b>500</b>	<b>640</b>	<b>+140</b>	
為替 レート	USD/円	105.00	107.40	+2.40
	EUR/円	120.00	125.45	+5.45

第3四半期以降の為替前提：USD/JPY105、EUR/JPY120

## 売上収益

- ・増収要因 ▲ 主力品（リクシアナ、インジェクタファー等）の売上拡大、為替影響による増加
- ・減収要因 ▼ エンハーツ（1患者あたりの投薬期間と投薬時に使用されるバイアル数の前提の見直し）、イナビルの需要減

## 売上原価

- ・売上収益の増収に伴う原価増

## 販売費・一般管理費

- ・売上収益の増収に伴う販促費用の増加、為替影響による増加

## 一過性の収益

- ・2021年度：大阪物流センター譲渡益

\* 当社は、経常的な収益性を示す指標として、営業利益から一過性の収益・費用を除外したコア営業利益を開示しています。  
一過性の収益・費用には、固定資産売却損益、事業再編に伴う損益（開発品や上市製品の売却損益を除く）、有形固定資産、無形資産、のれんに係る減損損失、損害賠償や和解等に伴う損益の他、非経常的かつ多額の損益が含まれます。  
本表では売上原価、販売費・一般管理費、研究開発費について、一過性の収益・費用を除く実績を示しています。

# 本日本話する内容

① 2021年度 第2四半期 連結決算

② 2021年度 業績予想

③ **ビジネスアップデート**

④ 研究開発アップデート

⑤ Appendix



# エンハーツ® : 販売状況アップデート

- ◆ 上市国での市場浸透により製品売上が着実に伸長
- ◆ 製品売上 : 2021年度 第2四半期累計 実績 **267億円** (対前年同期 **+144億円**)  
2021年度 予想 **627億円** (対前期 **+326億円**)



## 米国 (適応 : HER2+ 乳がん 3L、HER2+ 胃がん 2L)

- ◆ 製品売上 FY2021 Q2累計 実績 **197億円 (180 Mn USD)**  
FY2021 予想 **430億円 (400 Mn USD)**  
1患者あたりの投薬期間と投薬時に使用されるバイアル数の前提は7月公表予想から変更なし
- ◆ 対象市場で順調に成長
  - Q2も処方患者数が順調に拡大
  - 新規患者シェアが拡大中
    - HER2+ 乳がん 3Lのシェア 1位を維持
    - HER2+ 胃がん 2Lのシェアも順調に拡大中
  - 採用院数も計画通り拡大中
- ◆ **HER2+ 乳がん 2L の適応取得に向けて準備中**

## 欧州 (適応 : HER2+ 乳がん 3L)

- ◆ 製品売上 FY2021 Q2累計 実績 **26億円 (24 Mn USD)**  
FY2021 予想 **62億円 (58 Mn USD)**
- ◆ 上市国で順調に成長
  - Q2も処方患者数が順調に拡大
  - 新規患者シェアが拡大中 (フランスと英国におけるシェア 1位)
- ◆ **HER2+ 胃がん 2L の適応取得に向けて準備中**

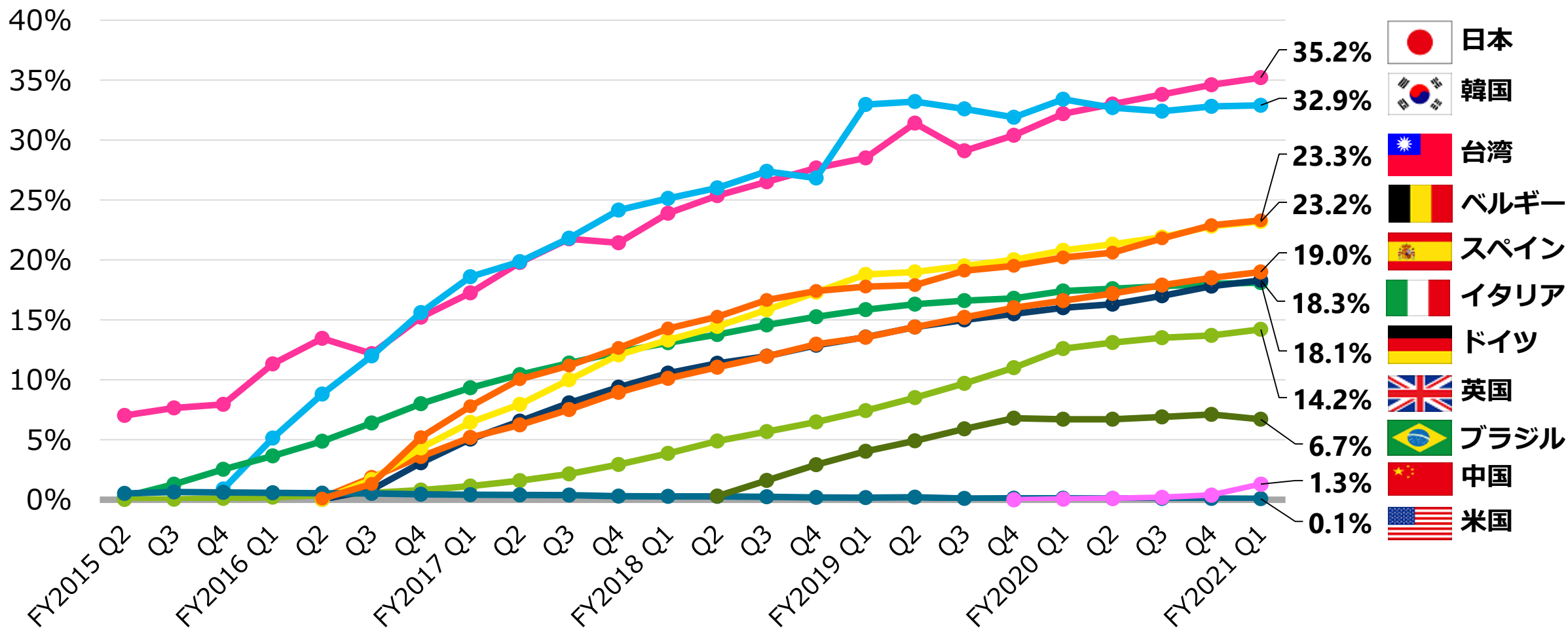
## 日本 (適応 : HER2+ 乳がん 3L、HER2+ 胃がん 3L)

- ◆ 製品売上 FY2021 Q2累計 実績 **44億円**  
FY2021 予想 **134億円**
- ◆ 対象市場で順調に成長
  - Q2も処方患者数が順調に拡大
  - 新規患者シェアが拡大中 (HER2+ 乳がん・胃がん 3Lのシェア 1位)
  - 採用院数も計画通り拡大中

# リクシアナ® : 各国における成長



**グローバル売上収益** 2021年度 第2四半期累計 実績 : **992億円** (対前年同期 +201億円)  
 2021年度 予想 : **1,967億円** (対前期 +307億円)

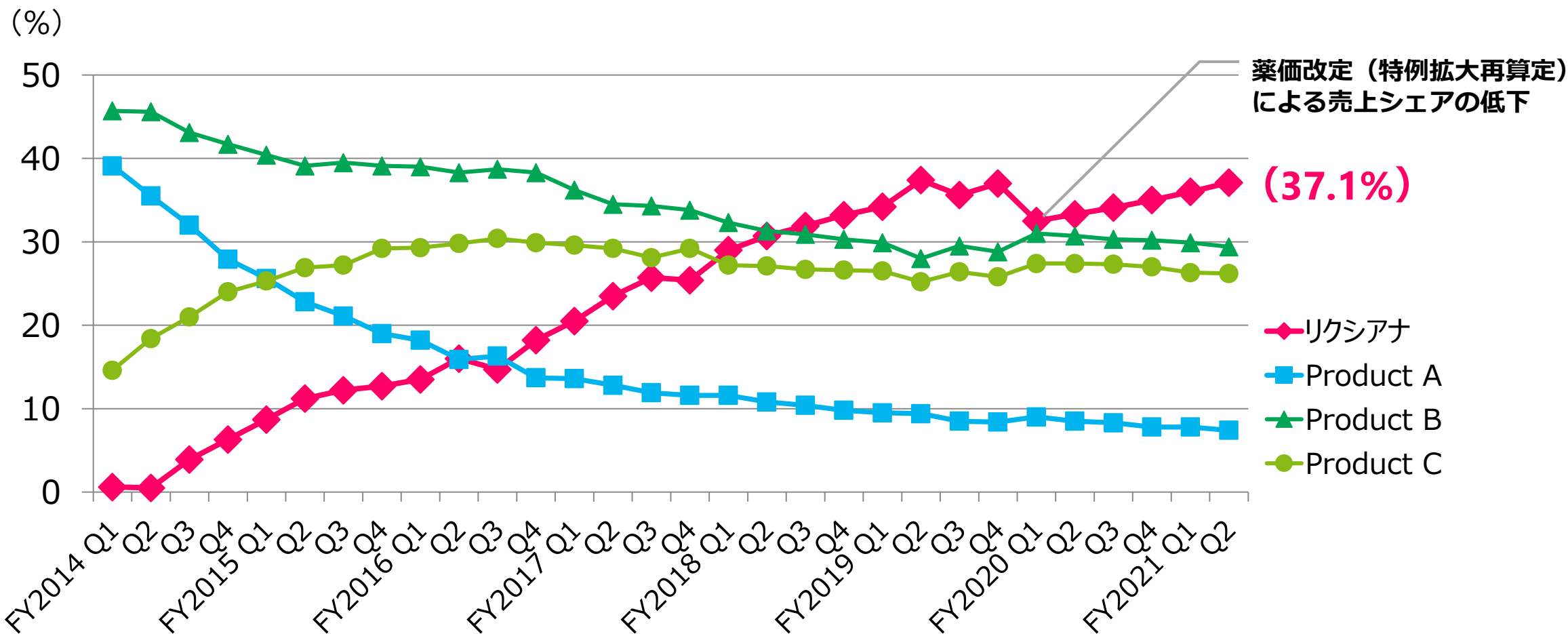




# リクシアナ<sup>®</sup>：日本における成長



- ◆ 売上シェア 1位 (2021年度 第2四半期：37.1%)
- ◆ 売上収益 2021年度 第2四半期累計 実績：448億円 (対前年同期+66億円)、2021年度 予想：930億円 (対前期+156億円)
- ◆ 2021年8月に出血リスクの高い高齢の非弁膜症性心房細動患者の脳卒中及び全身性塞栓症の発症抑制の用法及び用量追加の国内承認を取得



# 日本：片頭痛治療薬の販売提携

- ◆ 2021年8月に日本イーライリリー社と片頭痛発作治療薬ラスミジタンコハク酸塩（米国製品名：REYVOW®）の販売提携契約を締結

## 製品概要

- ◆ 一般名：**ラスミジタンコハク酸塩**
- ◆ 作用機序：**5-HT<sub>1F</sub>受容体作動薬**
  - 片頭痛病態への関連性が指摘されているセロトニン(5-HT)<sub>1F</sub>受容体を選択的に結合し、5-HT<sub>1F</sub>受容体を作動することで、中枢での疼痛伝達や三叉神経系の過活動を抑制し、三叉神経からの片頭痛に関わる神経伝達物質の放出を抑制
- ◆ 目標とする適応：**片頭痛**
- ◆ 投与方法：**経口投与**
- ◆ 開発ステージ：**国内申請中**

## 契約内容

- ◆ 販売提携
  - 第一三共  
**日本イーライリリー社との共同販促のもと、流通、販売を担当（売上計上）**
  - 日本イーライリリー社  
**開発、製造及び販促を担当**

## 提携意義

- ◆ 既に両社で販売提携を行っている片頭痛発作発症抑制薬**エムガルティ®**と本剤による片頭痛のトータルケアサポートを通じて、**より多くの片頭痛患者のQOL改善**に貢献
- ◆ **国内事業**の持続的成長に向けた**製品ポートフォリオの拡充**



# 本日本話しする内容

① 2021年度 第2四半期 連結決算

② 2021年度 業績予想

③ ビジネスアップデート

**④ 研究開発アップデート**

⑤ Appendix



## ESMO 2021ハイライト

3ADC アップデート

Alpha アップデート

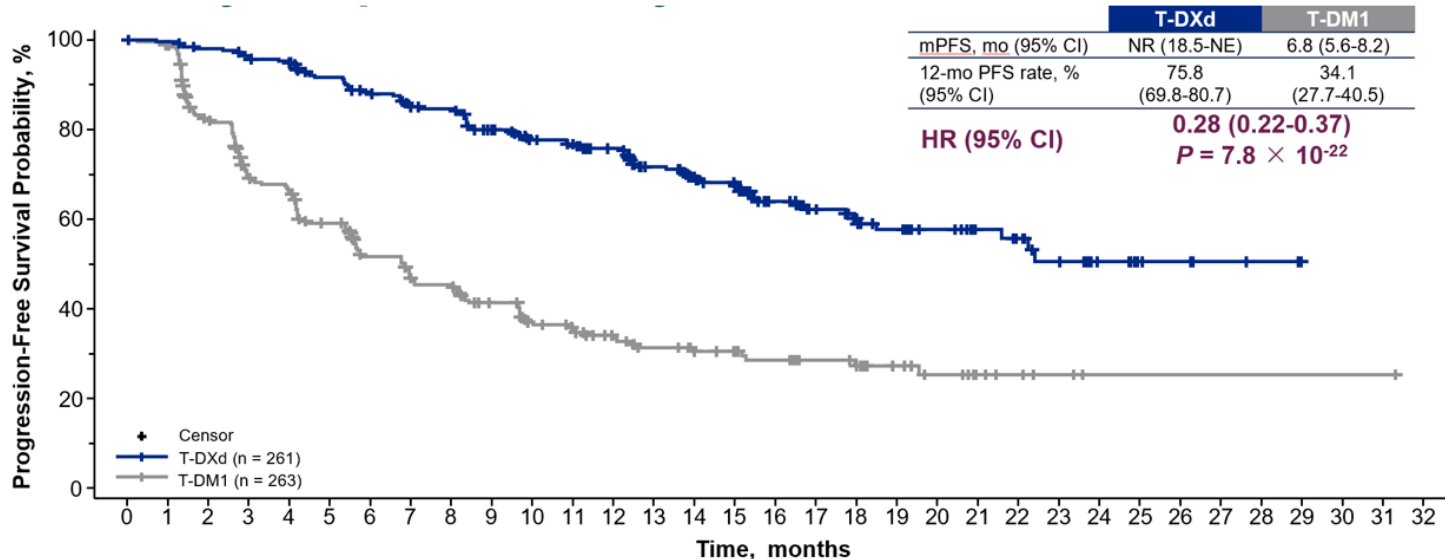
R&D Day

今後のニュースフロー

◆ 今年のESMOでは、乳がん患者の治療を変革しうる**画期的なデータ**を示すとともに、複数のがんに対する**当社独自のADC技術の強み**がさらに示された

- エンハーツ®およびDato-DXdに関する4つのlate breakingセッションでの発表
- 4つ目のDXd-ADCであるDS-7300の初めての臨床データの発表

## DESTINY-Breast03 有効性 主要評価項目：PFS（盲検下独立中央判定）



Median PFS follow-up for T-DXd was 15.5 months (range, 15.1-16.6) and for T-DM1 was 13.9 months (range, 11.8-15.1)  
HR, hazard ratio; INV, investigator; mo, month; NE, not estimable; NR, not reached; PFS, progression free survival

## DESTINY-Breast03 安全性 薬剤に関連するILD/肺炎の発現割合<sup>a</sup>

Adjudicated as drug-related ILD/pneumonitis <sup>a</sup> , n (%)			
n (%)	Grade 1	Grade 2	Grade 3
T-DXd (n = 257)	7 (2.7)	18 (7.0)	2 (0.8)
T-DM1 (n = 261)	4 (1.5)	1 (0.4)	0

	Grade 4	Grade 5	Any Grade
	0	0	27 (10.5)
	0	0	5 (1.9)

<sup>a</sup>Patients with prior history of ILD/pneumonitis requiring steroids were excluded  
ILD, interstitial lung disease

- ◆ HER2陽性乳がん患者において、T-DM1と比較して統計的に有意かつ臨床的に意義のある、前例のないPFSの改善を示した
- ◆ グレード4および5のILD/肺炎は見られず、管理可能な安全性プロファイルを示した

◆ 乳がんに加えて非小細胞肺がんや胃がんなどのHER2が標的になりうる複数のがん治療においてもエンハーツ®が変革をもたらす可能性を示した

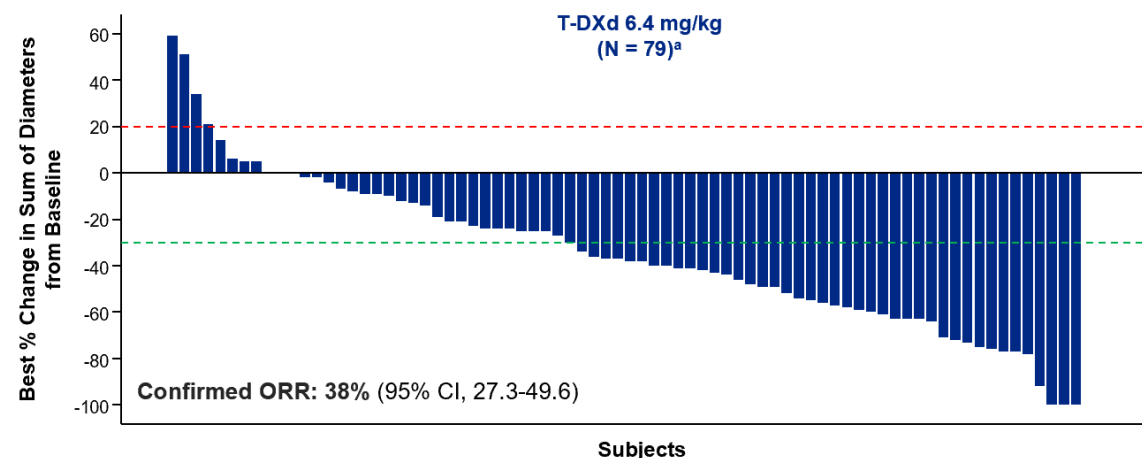
## DESTINY-Lung01 HER2遺伝子変異 NSCLC、2次治療、グローバルPh2

	Patients (N = 91)
Confirmed ORR <sup>a</sup> , n (%)	50 (54.9) (95% CI, 44.2-65.4)
Best overall response, n (%)	
CR	1 (1.1)
PR	49 (53.8)
SD	34 (37.4)
PD	3 (3.3)
Not evaluable	4 (4.4)
DCR, n (%)	84 (92.3) (95% CI, 84.8-96.9)
Median DoR, months	9.3 (95% CI, 5.7-14.7)
Median follow up, months	13.1 (range, 0.7-29.1)

<sup>a</sup>Primary endpoint  
CR, complete response; DoR, duration of response; NSCLC, non small cell lung cancer; PD, progressive disease; PR, partial response; SD, stable disease.

未だ承認薬がないHER2遺伝子変異 NSCLCにおいて、HER2を標的とする治療が堅牢で持続的な有効性を示す可能性を示した

## DESTINY-Gastric02 HER2陽性 胃がん、2次治療、西洋人Ph2



<sup>a</sup>3 patients were missing baseline or post-baseline target lesion assessment.  
Red line at 20% indicates progressive disease; green line at -30% indicates partial response.  
Analysis conducted in the full analysis set.

HER2陽性 胃がん2次治療における西洋人を含む初めての試験において持続的な有効性を示した



ESMO 2021ハイライト

**3ADC アップデート**

Alpha アップデート

R&D Day

今後のニュースフロー

# エンハーツ® : HER2陽性 乳がん

## ◆ DESTINY-Breast03試験 (HER2+, 2L, Ph3)

- 2021年8月：データ入手  
FDAよりリアルタイムオンコロジーレビュー\* (RTOR) の対象に指定
- 2021年9月：ESMOにてデータ発表  
FDAより画期的治療薬（ブレイクスルーセラピー）に指定
- FY2021 Q3：規制当局への申請を予定

## ◆ DESTINY-Breast03試験のデータにより、HER2陽性 乳がんにおけるすべての臨床試験への自信が大いに高まった

← 早期治療

ネオアジュバント	ネオアジュバント後 残存浸潤性乳がん	進行/転移性 1次治療	進行/転移性 2次治療	進行/転移性 3次治療
DESTINY-BreastXX Ph3 計画中	DESTINY-Breast05 Ph3 2020年12月開始	DESTINY-Breast09 Ph3 2021年6月開始	DESTINY-Breast03 Ph3 FY2021 Q3申請予定	DESTINY-Breast01 Ph2 上市

\*RTORは、患者さんが安全かつ効果的な治療をできるだけ早期に受けられるよう、より効率的な審査プロセスの探求を目指しています。RTORにより、申請者が正式に完全な申請書を提出する前に、FDAが多くのデータを早期に審査することが可能となります。



# エンハーツ® : 胃がん・非小細胞肺がん等

## HER2陽性 胃がん



- ◆ **DESTINY-Gastric01** (3L, Ph2, 日韓) 、  
**DESTINY-Gastric02** (2L, Ph2, 欧米)  
データをもとに欧州にてFY2021 Q3に  
申請予定



- ◆ **DESTINY-Gastric06** (3L, Ph2, 中国)  
試験を2021年9月に開始

## エンハーツ®の中国開発

- ◆ 中国開発に強みを持つアストラゼネカとの協業により  
現在は乳がん・胃がんを中心に中国開発を進めている
- ◆ 中国における申請では、基本的に中国人の臨床データ  
が求められるため、以下の臨床試験で中国人患者を  
組み入れ中
  - 乳がん : DESTINY-Breast03, 04, 05, 06
  - 胃がん : DESTINY-Gastric03, 04, 06

## HER2遺伝子変異 NSCLC

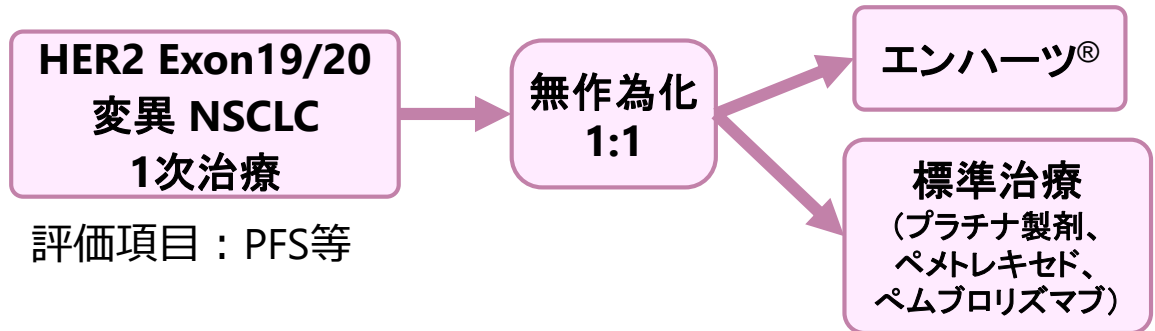
### ◆ 進行/転移性 2次治療以降

- FDAより画期的治療薬に指定
- **DESTINY-Lung01** (2L, Ph2) データを  
ESMO 2021にて発表
- 申請計画について当局と協議中

### ◆ 進行/転移性 1次治療

- **DESTINY-Lung04** (1L, Ph3) 試験を  
FY2021 Q3に開始予定

## DESTINY-Lung04試験デザイン





# Dato-DXd : 非小細胞肺癌

## ◆ TROPION-Lung08試験実施に向けて2021年9月にメルクと契約締結

- アクショナブル遺伝子変異がなく、PD-L1を高発現しているNSCLCの1次治療が対象
- 現在の標準治療は免疫療法±プラチナ製剤であるが、約40~60%は病態が進行するため、画期的な治療アプローチが求められている

### アクショナブル遺伝子変異なし NSCLC

進行/転移性  
1次治療

進行/転移性  
2次治療

進行/転移性  
3次治療

#### TROPION-Lung01

Ph3, Dato-DXd vs ドセタキセル

#### TROPION-Lung02

Ph1b, Dato-DXd + ペムブロリズマブ ± プラチナ製剤

#### TROPION-Lung04

Ph1b, Dato-DXd + デュルバルマブ ± プラチナ製剤

#### TROPION-Lung08

Ph3, Dato-DXd + ペムブロリズマブ  
vs ペムブロリズマブ

ESMO 2021ハイライト

3ADC アップデート

**Alpha アップデート**

R&D Day

今後のニュースフロー

# 第一三共DXd-ADCフランチャイズ

プロジェクト (標的抗原)	可能性のある適応症	研究	前臨床	フェーズ 1	フェーズ2	フェーズ3	申請	上市	
1 エンハーツ® (HER2)	乳がん、胃がん、 非小細胞肺癌ん、 大腸がんなど	[Progress bar from Research to Marketing]							
2 Dato-DXd (TROP2)	非小細胞肺癌ん、 乳がんなど	[Progress bar from Research to Phase 3]							
3 HER3-DXd (HER3)	非小細胞肺癌ん、 大腸がん、乳がん	[Progress bar from Research to Phase 2]							
4 DS-7300 (B7-H3)	食道扁平上皮がん、 前立腺がん、 小細胞肺癌んなど	[Progress bar from Research to Phase 1]							
5 DS-6157 (GPR20)	消化管間質腫瘍	[Progress bar from Research to Phase 1]							
6 DS-6000 (CDH6)	腎臓がん、 卵巣がん	[Progress bar from Research to Phase 1]							
7 DS-3939 (TA-MUC1)	固形がん	[Progress bar from Research to Phase 1]							
8 DS-XXXX (非開示)	非開示	[Progress bar from Research to Phase 1]							

■ タイムラインは各プロジェクトで最も進んでいるステージを示している

## 標的抗原 : GPR20

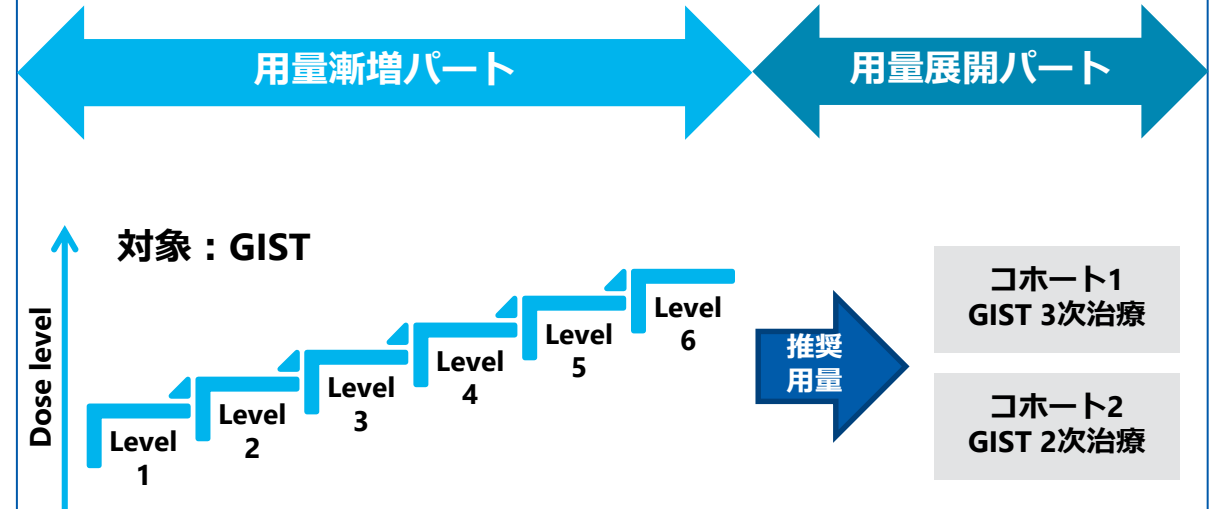
- ◆ オーフアンGタンパク質共役受容体 (GPCR)
- ◆ GIST (消化管間質腫瘍) に特異的に高発現
- ◆ GISTの起源細胞であるカハールの間質細胞は唯一のGPR20陽性細胞
- ◆ GISTにおける機能は不明

## GIST (消化管間質腫瘍)

- ◆ 消化管の間葉系腫瘍で希少疾患
- ◆ 胃に60%、小腸に35% 見られる
- ◆ KITの発がん突然変異 (~80%) 、PDGFRA遺伝子変異 (~5%) により発症
- ◆ 複数のチロシンキナーゼ阻害剤が承認されている

## Ph1試験

### Ph1試験デザイン



用量漸増パートで1.6 mg/kg から12.8 mg/kgまでの6用量で安全性を評価

- ◆ Ph1試験用量漸増パートでGISTに対して明確な有効性シグナルが見られなかった
- ◆ 用量展開パートへ移行せずにDS-6157の**開発中止**を判断
- ◆ 有効性が見られなかった要因について詳細解析中、2022年度学会にてPh1データを発表予定

# DS-5670 (COVID-19 mRNAワクチン) の特徴：抗原のデザイン

DS-5670は新型コロナウイルスのスパイク蛋白質全長ではなく  
**受容体結合領域 (RBD)** を標的にしている

## スパイク蛋白質全長



### ◆ mRNAの長さ

- 4.1 kb

### ◆ 想定されるメリット

- RBD以外の部分に中和エピトープやT細胞エピトープを含んでいる可能性があるため、多様なエピトープの抗原特異的な免疫応答を誘導することができる

エピトープ：抗体、B細胞、T細胞等によって認識される抗原の一部

## 受容体結合領域 (RBD)



### ◆ mRNAの長さ

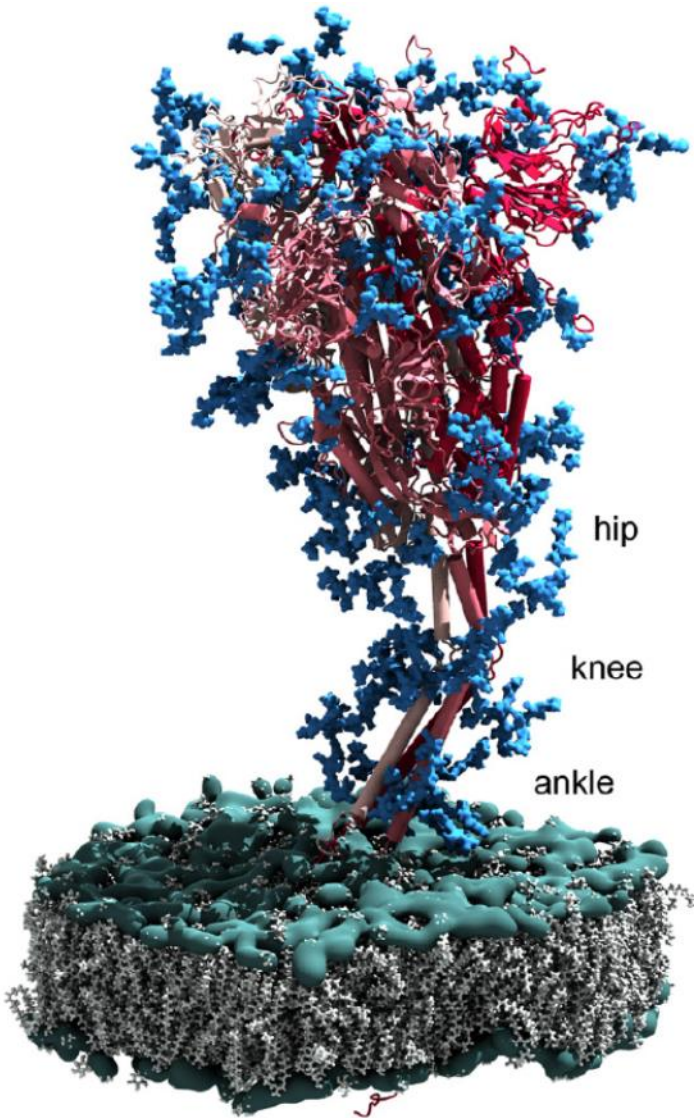
- 1.0 kb

### ◆ 想定されるメリット

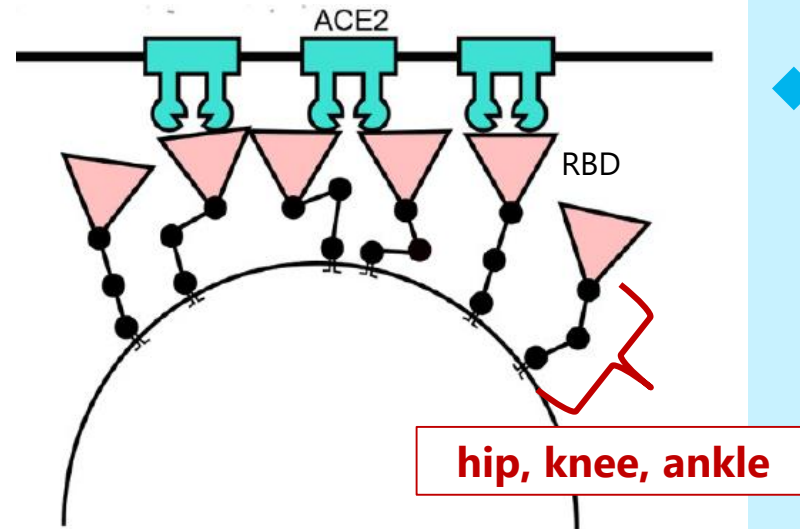
- スパイク蛋白質全長より短いため、効率的かつ安定な状態で核酸をLNPに封入することができる
- スパイク蛋白質全長と比較して病原性エピトープが少ない可能性があることから、感染増強のリスクが低い

(CELL 12060 <https://doi.org/10.1016/j.cell.2021.05.032>PNAS 117:8218 2020、Vaccine 25:2832 2007)

# スパイクタンパク質全長抗原に対するRBD抗原の優位性



(B. Turoňová et al., Science 10.1126/science.abd5223 (2020).)

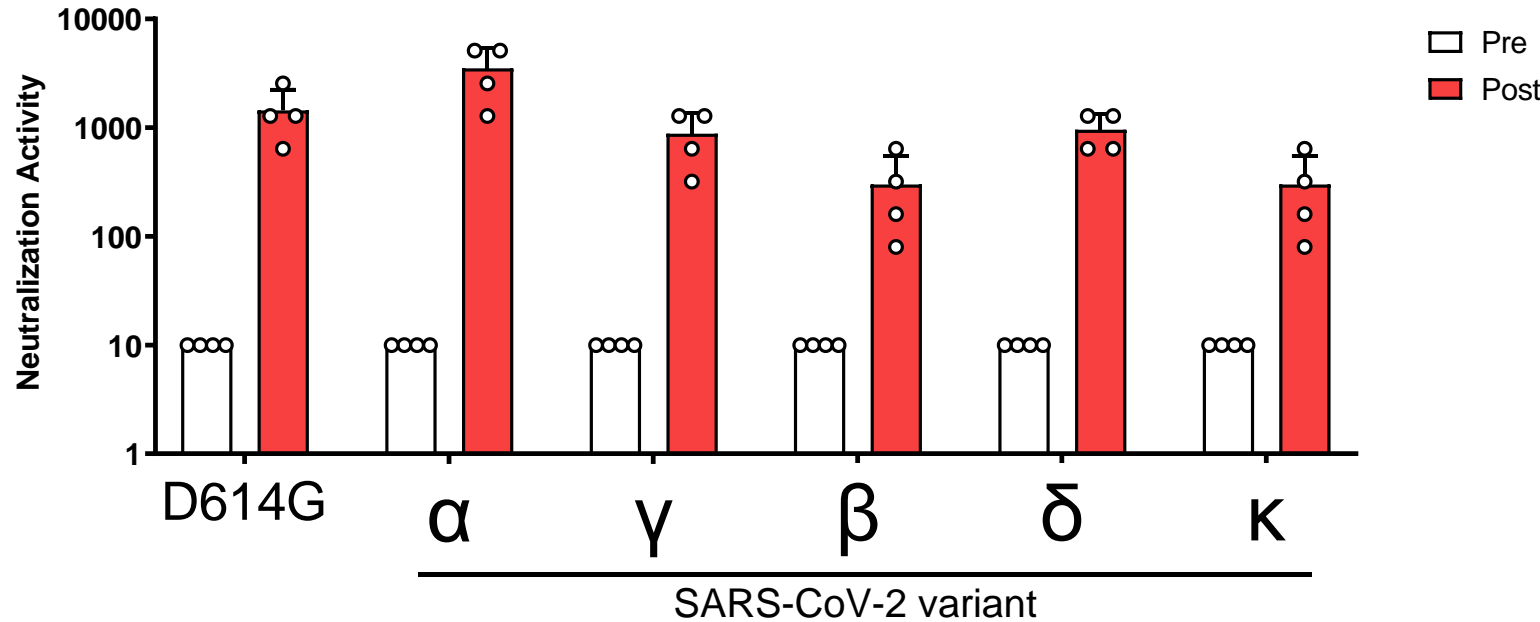


(B. Turoňová et al., Science  
10.1126/science.abd5223 (2020).)

- ◆ RBDとACE2の結合は、RBD以外の領域 (hip、knee、ankle) によっても制御される
- ◆ 変異株の**スパイク蛋白質全長**抗原を用いた場合：
  - RBD以外の領域の変異が、RBD内の中和エピトープの免疫原性に影響する可能性がある（免疫回避を考慮すると免疫原性は低くなる可能性が高い）
- ◆ 変異株の**RBD**抗原を用いた場合：
  - RBD以外の領域の変異による影響を受けない。また、中和活性に影響する変異箇所を絞り込みやすい

# DS-5670 : 変異株に対する中和活性誘導

- カニクイザル
- mRNA換算でDS-5670を50 μg/body
- 1回/2週、計3回、上腕三角筋筋肉内に投与（4頭/群）
- 3回目投与から2週後に採取した血漿を用いて、中和活性を測定（AMED河岡班）



Variant	Mutation in RBD
α	N501Y
γ	K417T/E484K/N501Y
β	K417N/E484K/N501Y
δ	L452R/T478K
κ	L452R/E484Q

Monkey ID	SARS-CoV-2 variant					
	D614G	α	γ	β	δ	κ
#1	640	2560	640	160	1280	160
#2	2560	5120	1280	640	640	640
#3	1280	5120	1280	320	1280	320
#4	1280	1280	320	80	640	80



## Ph1/2試験デザイン

日本人健康成人  
および健康高齢者

無作為化

DS-5670

プラセボ

- ◆ **目的** : 安全性、免疫原性、および推奨用量の検討
- ◆ **目標症例数** : 152例
- ◆ **投与方法** : 計2回の筋肉内注射、4週間間隔
- ◆ **主要評価項目** : 安全性、中和抗体価
- ◆ **副次評価項目** : IgG抗体価、薬物動態

## Ph1/2試験結果

- ◆ **2021年3月に試験を開始し、同年10月にTLRを入手**
  - 2回の投与を完了した142例において、2回目投与4週間後までに安全性上の大きな問題は認められなかった
  - 中和抗体価やIgG抗体価の上昇が確認された
  - 現在、入手したデータの詳細解析を実施中

## COVID-19ワクチンとしての可能性を示唆する結果がPh1/2試験から得られた

\*本成果は、AMEDが実施する創薬支援推進事業「新型コロナウイルス感染症（COVID-19）に対するワクチン開発（企業主導型）」で獲得されました。

IgG抗体価：抗体の一つであるIgGの量で、抗原特異的な免疫応答の指標

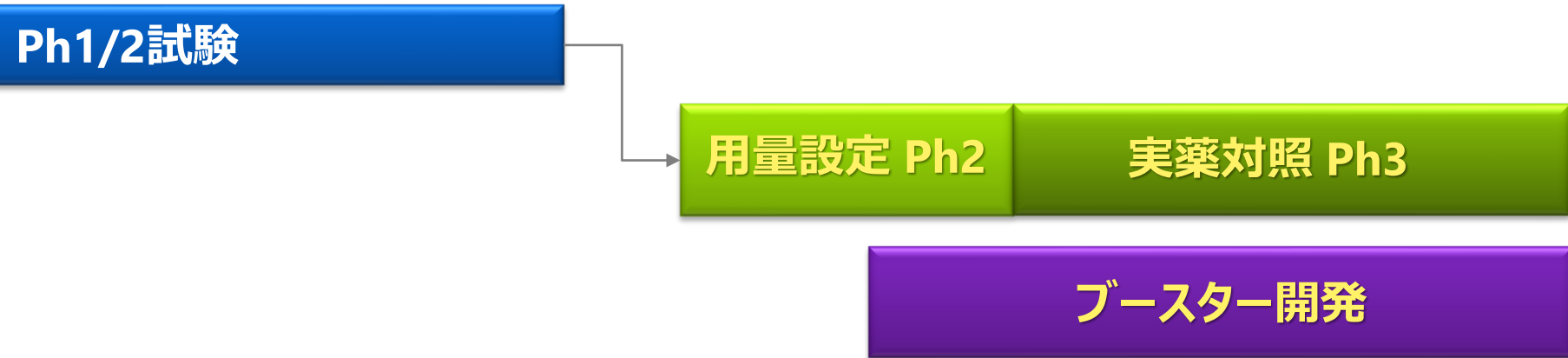
TLR: top line results



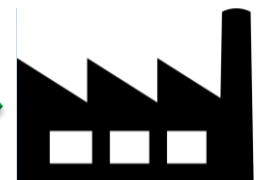
# DS-5670 : 今後の開発計画

- ◆ 用量設定のための**Ph2試験**を本年11月に開始予定
  - ✓ より安定した品質を得るべくプロセスを最適化した治験薬で、安全性の確認及びPh3試験の用量を決定するのが目的
- ◆ 実薬対照**Ph3試験**を2021年度中に開始予定。具体的な試験内容について当局と協議中
- ◆ 暦年2022年中の**実用化**を目指す

FY2020		FY2021		FY2022	
2H	1H	2H	1H	2H	2H



第一三共バイオテックにて、生産体制構築



ESMO 2021ハイライト

3ADC アップデート

Alpha アップデート

**R&D Day**

今後のニュースフロー

眞鍋 淳  
代表取締役社長  
兼 CEO



竹下 健一  
グローバル  
R&D Head



日時

1回のみ開催

➤ 12/14 (火) 17:30-19:00 EST , 12/15 (水) 7:30-9:00 JST

開催形式

バーチャル、電話会議

ESMO 2021ハイライト

3ADC アップデート

Alpha アップデート

R&D Day

**今後のニュースフロー**

## 学会発表予定

サンアントニオ乳癌シンポジウム (Dec 7-10)	
<b>Dato-DXd</b>	<b>TROPION-PanTumor01 TNBCコホートデータ</b>
米国血液学会 (Dec 11-14)	
<b>DS-3201</b>	<b>成人T細胞白血病/リンパ腫 Ph2 データ</b>

## 承認見込み

<b>エフィエント®</b>	虚血性脳血管障害 <ul style="list-style-type: none"> <li>日本: 2021年度 第3四半期</li> </ul>
----------------	--

## 承認申請予定

<b>エンハーツ®</b>	<b>DESTINY-Breast03: HER2陽性乳がん, 2L, Ph3</b> <ul style="list-style-type: none"> <li>2021年度 第3四半期</li> </ul> <b>DESTINY-Gastric01/02: HER2陽性胃がん, 2/3L, Ph2</b> <ul style="list-style-type: none"> <li>欧州: 2021年度 第3四半期</li> </ul>
<b>DS-3201</b>	申請用Ph2: 成人T細胞白血病/リンパ腫 <ul style="list-style-type: none"> <li>日本: 2021年度 下半期</li> </ul>

## 主要データの入手見込み

<b>エンハーツ®</b>	DESTINY-Breast04: HER2低発現乳がん, ポスト化学療法, Ph3 <ul style="list-style-type: none"> <li>2021年度 第4四半期</li> </ul>
<b>キザルチニブ</b>	QuANTUM-First: 急性骨髄性白血病, 1L, Ph3 <ul style="list-style-type: none"> <li>2021年度 第3四半期</li> </ul>

## ピボタル試験開始見込み

<b>エンハーツ®</b>	<b>DESTINY-Lung04: HER2遺伝子変異NSCLC, 1L, Ph3</b> <ul style="list-style-type: none"> <li>2021年度 第3四半期</li> </ul>
<b>Dato-DXd</b>	<b>TROPION-Lung08: アクシヨナブル遺伝子変異なしNSCLC, 1L, Ph3</b> <ul style="list-style-type: none"> <li>2021年度 第4四半期</li> </ul>
<b>DS-5670</b>	<b>Ph3: COVID-19 mRNAワクチン</b> <ul style="list-style-type: none"> <li>2021年度 第4四半期</li> </ul>

# 本日本話しする内容

① 2021年度 第2四半期 連結決算

② 2021年度 業績予想

③ ビジネスアップデート

④ 研究開発アップデート

⑤ **Appendix**



# 2021年度の主要マイルストーン (3ADC)

2021年10月現在



プロジェクト	目標適応 [フェーズ, 試験名]	FY2021				
		Q1	Q2	Q3	Q4	
エンハーツ®	乳がん	HER2+, 2L [P3, DESTINY-Breast03]		TLR入手	申請見込み	
		HER2 low, 化学療法既治療 [P3, DESTINY-Breast04]				TLR入手見込
		HER2+, 1L [P3, DESTINY-Breast09]	試験開始			
	胃がん	HER2+, 2L [P2, DESTINY-Gastric02]	TLR入手		申請見込み (欧州)	
		HER2+, 2L [P3, DESTINY-Gastric04]	試験開始			
	NSCLC	<b>HER2+, 3L [P2, DESTINY-Gastric06]</b>		試験開始		
		HER2+/変異, 2L [P2, DESTINY-Lung01]	TLR入手			
Dato-DXd	HER2+, 併用 [P1b, DESTINY-Lung03]			試験開始予定		
	<b>HER2変異, 1L [P3, DESTINY-Lung04]</b>			試験開始予定		
HER3-DXd	TNBC, デュルバルマブ併用 [P1b/2, BEGONIA]	試験開始				
	<b>アクションナブル遺伝子変異なしNSCLC, 1L, ペムブロリズマブ併用 [P3, TROPION-Lung08]</b>				試験開始予定	
	EGFR変異NSCLC, オシメルチニブ併用 [P1]	試験開始				

赤字下線 : FY2021 Q1からの追加またはアップデート

NSCLC : 非小細胞肺癌, TNBC : トリプルネガティブ乳がん, TLR: Top Line Results

# 2021年度の主要マイルストーン (Alpha)

プロジェクト	目標適応 [フェーズ, 試験名, 地域]	FY2021			
		Q1	Q2	Q3	Q4
キザルチニブ	急性骨髄性白血病, 1L [P3, 日米欧亜]			TLR入手見込	
ペキシダルチニブ	腱滑膜巨細胞腫 [P2, 日]	試験開始			
テセルパツレブ/G47Δ	悪性神経膠腫 [IIS, 日]	承認			
DS-3201	成人T細胞白血病/リンパ腫 [P2申請用, 日]		TLR入手	申請見込み (日本)	
	末梢性T細胞リンパ腫 [P2申請用, 日米欧亜]	試験開始			
DS-1594	急性骨髄性白血病、急性リンパ性白血病 [P1/2, 米]	試験開始			
リクシアナ <sup>®</sup>	超高齢者心房細動 [P3, ELDERCARE-AF, 日]		承認		
エフィエント <sup>®</sup>	虚血性脳血管障害 [P3, PRASTRO III, 日]			承認見込	
タリージェ <sup>®</sup>	中枢性神経障害性疼痛 [P3, 日]	申請			
DS-6016	進行性骨化性線維異形成症 [P1, 日]	試験開始			
VN-0200	RSウイルス予防ワクチン [P1, 日]	試験開始			
DS-5670	COVID-19 mRNAワクチン [P2, 日]			試験開始予定	
	COVID-19 mRNAワクチン [P3, 未定]				試験開始予定

赤字下線 : FY2021 Q1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 : 3ADC

フェーズ1	フェーズ2	フェーズ3	申請中
(日米) NSCLC, TNBC, HR+ BC TROPION-PanTumor01	(米欧亜) HER2+ BC 2L~/1L DESTINY-Breast07	(米欧亜) TNBC (テニバルマフ併用) BEGONIA	(日米欧亜)HER2+ BC 3L DESTINY-Breast02
(日米欧亜) NSCLC (actionable遺伝子 変異なし, ハムゲリスマフ併用) TROPION-Lung02	(米欧亜) HER2低発現 BC 化学療法未治療/既治療 DESTINY-Breast08	(米欧) HER2+ GC 2L DESTINY-Gastric02	(日米欧亜) HER2+ BC 2L DESTINY-Breast03
(日米欧亜) NSCLC (actionable遺伝子 変異なし, テニバルマフ併用) TROPION-Lung04	(米欧亜) HER2+ GC 併用, 2L~/1L DESTINY-Gastric03	(中国) HER2+ GC 3L DESTINY-Gastric06	(日米欧亜) HER2低発現 BC 化学療法既治療 DESTINY-Breast04
(米欧亜) TNBC (テニバルマフ併用) BEGONIA	(欧亜)HER2+ NSCLC (テニバルマフ併用) 1L DESTINY-Lung03	(日米欧)HER2+/変異NSCLC 2L~ DESTINY-Lung01	(日米欧亜) HER2+ BC ポストネオアジバント DESTINY-Breast05
(日米欧亜) NSCLC	(米欧) BC, 膀胱がん (ニホルマフ併用)	(日米欧亜)HER2変異NSCLC 2L~ DESTINY-Lung02	(日米欧亜) HER2低発現 BC 化学療法未治療 DESTINY-Breast06
(日米)EGFR変異NSCLC (オシメルチニブ併用)	(米欧) BC, NSCLC (ハムゲリスマフ併用)	(米欧亜) NSCLC (テニバルマフ併用) 2L~ HUDSON	(米) HER2+ BC 1L DESTINY-Breast09
(日米) BC		(日米欧) HER2+ CRC 3L DESTINY-CRC01	(日欧亜) HER2+ GC 2L DESTINY-Gastric04
		(日米欧亜) HER2+ CRC 3L DESTINY-CRC02	(米欧亜) NSCLC (HER2 exon 19 または exon 20 変異あり) 1L DESTINY-Lung04
		(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	
		(日米欧亜) EGFR変異NSCLC HERTHENA-Lung01	
		(日米欧) 大腸がん 3L	

- エンハーツ®
- Dato-DXd
- HER3-DXd

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  
 : 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  
 : プ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

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 食道扁平上皮がん、前立腺がん、 小細胞肺癌等	DS-3201 (日米) EZH1/2阻害剤 非ホジキンリンパ腫	DS-3201 (日) EZH1/2阻害剤 ATL/L	キザルチニブ (日米欧亜) FLT3阻害剤 1L AML	タリージェ (日) α2δリガンド 中枢性神経障害性疼痛
DS-6000 (米) 抗CDH6 ADC 腎細胞がん、卵巣がん	PLX2853 (米) BET阻害剤 AML	DS-3201 (日米欧亜) EZH1/2阻害剤 PTCL	ベキシダルチニブ (日亜) CSF-1/KIT/FLT3阻害剤 腱滑膜巨細胞腫	エフィント(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-1001 (日) 変異型IDH1阻害剤 神経膠腫	ミネプロ (日) ミネラルコルコイト受容体ブロッカー 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-1211 (米) TNAP阻害剤 弾性線維性仮性黄色腫	PLX2853 (米) BET阻害剤 婦人科腫瘍、卵巣がん	DS-5141 (日) ENAオリゴヌクレオチド DMD	VN-0102/JVC-001 (日) 麻しんおたふくかぜ風しん混合ワクチン	
DS-6016 (日) 抗ALK2抗体 進行性骨化性線維異形成症	PLX2853 (米) BET阻害剤 前立腺がん			
DS-5670 (日) mRNAワクチン COVID-19	DS-1594 (米) Menin-MLL結合阻害剤 AML, ALL			
	VN-0200 (日) RSウイルスワクチン RSウイルス			

- 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、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

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](mailto:DaiichiSankyoIR@daiichisankyo.co.jp)