

2019年7月22日

<報道関係各位>

ギリアド・サイエンシズ株式会社

当資料は、米国ギリアド・サイエンシズ社が、2019年7月22日（現地時間）に発表した英文プレスリリースを日本語に翻訳、一部編集したものです。正式な言語は英語であり、その内容ならびに解釈については英語が優先いたします。

ギリアドが HIV 感染者を対象としたファーストインクラスの カプシド阻害薬である GS-6207 に関する概念実証データを発表 —第 1b 相試験で GS-6207 の単回皮下注射後に強力な抗ウイルス効果を実証、 有害事象による中止なし—

ギリアド・サイエンシズ（本社：米カリフォルニア州フォスターシティ、ナスダック：GILD、以下「ギリアド」）は7月22日、HIV感染者を対象とした、HIVカプシド機能に対するファーストインクラスの開発中の新規選択的阻害薬であるGS-6207に関する初めての臨床データを発表しました。第1b相のデータは、HIVカプシド阻害が *in vivo* においてウイルス量を著しく減少させる可能性があるという、これまでにはなかった実証概念を証明するものです。さらにギリアドは、GS-6207が *in vitro* において、HIV治療で使用される他のクラスの薬剤に対する交差耐性が生じなかったことを示す前臨床データも発表しました。これらのデータはメキシコシティで開催される第10回国際エイズ学会（10th International AIDS Society Conference on HIV Science, IAS 2019）で発表されました。

GS-6207は、皮下投与可能な、開発中の長時間作用型の抗レトロウイルス薬です。GS-6207は、多くの治療歴を有する多剤耐性のHIV感染者の治療薬になる可能性があるとして、先般、米国食品医薬品局（FDA）から画期的治療薬の指定を受けました。ウイルスの遺伝物質と必須酵素を包み込み、それらを保護するタンパク質であるHIVカプシドの活性を阻害することにより、現在承認されている抗レトロウイルス薬とは異なる全く新しい作用機序で、GS-6207は効果を発揮します。GS-6207は、ウイルスのライフサイクルにおいて異なる複数の過程、特にウイルスが感染性となったり、非感染細胞に侵入することを阻害すると考えられています。

「IASで発表されたデータは、ギリアドが、HIV治療薬開発でこれまでに達成してきた革新的進歩を基盤として、科学的発見に取り組んでいることをはっきりと示すものです。」と、ギリアドのHIVおよびエマージングウイルス感染症担当のシニアバイスプレジデントであるダイアナ・ブレイナー（Diana Brainard, MD）は述べています。「GS-6207の持つ複数の作用機序は、現在承認されている抗レトロウイルス薬のクラスに属する薬剤のものとは大きく異なっており、HIV感染者を対象とし

た長時間作用型の治療レジメンの開発において新たな道を示すことになるかもしれません。」

IAS 2019 で発表された GS-6207 に関する研究には以下が含まれます。

ポスターLBPEB13：HIV 感染者を対象としたファーストインクラス、長時間作用型の HIV カプシド阻害薬である、GS-6207 の単回皮下投与後、10 日間の安全性および抗ウイルス活性

この進行中の第 Ib 相試験では、カプシド阻害薬による治療を受けたことのない HIV 感染者を、GS-6207（用量は 50mg、150mg および 450mg。1 用量当たり n=6）の単回皮下注射群とプラセボ群（n=6）とに無作為に割り付けしました。主要評価項目は、10 日間の治療期間における HIV-1 RNA の最大減少量でした。各用量群における 10 日目までの HIV-1 RNA の平均最大減少量は、 $1.8\sim 2.2\log_{10}\text{copies/mL}$ の範囲であり、プラセボと比較して、いずれの群でも有意かつ顕著な減少がみられました（いずれも $p<0.0001$ ）。重篤な有害事象が発現した、または有害事象により投与を中止した被験者はいませんでした。主な有害事象は、軽度から中等度の注射部位の反応でしたが（63%、24 例中 15 例）、その全てが限定性なものでした。

「本試験は、HIV カプシド阻害がウイルス量を著しく減少させる可能性があるという、これまでにはなかった臨床エビデンスを提供し、有効な抗レトロウイルスレジメンの成分としての GS-6207 に対する評価をさらに進めることを支持するものです。また、長時間作用型レジメンにより、HIV 感染者の中には毎日錠剤を服用することから生じる負担が軽減される人もいます。」と、ハーバー-UCLA メディカル・センター（Harbor-UCLA Medical Center）の HIV 治療薬部門長であり、本研究の筆頭著者でもあるエリック・ダール医師（Eric Daar, MD）は述べています。「初期の試験から得られたこれらの結果は、GS-6207 が長時間作用型 HIV 治療薬の中で果たす役割を理解するための次の臨床開発段階に進むことを後押しするものです。」

ポスターTUPEA075：長時間作用型抗ウイルス新薬として臨床開発中の、ファーストインクラスのピコモル HIV カプシド阻害薬である GS-6207 の *in vitro* 耐性プロファイル

この *in vitro* 試験では、HIV 感染細胞を対象として GS-6207 に対する耐性の出現を初めて評価しました。治療濃度以下の GS-6207 で発現した変異は、L56I、Q67H、N74D/S または T107N でした。これらカプシドの変異の一つ以上が含まれるウイルスでは、GS-6207 に対する感受性が低下しましたが、他のクラスの抗レトロウイルス薬に対する感受性は完全に保たれていました。GS-6207 で発現した変異は、高度に保存されたカプシド残基（94～100%）で見られましたが、治療歴のない HIV 感染者のウイルス分離株では極めてまれ（1%未満）でした。GS-6207 に対する *in vitro* 耐性は、一般的に感染力の低下と複製能の低下と関連していましたが、これはウイルス複製サイクルにおけるカプシドの重要性を強調するものです。

GS-6207 は治験薬であり、いずれの国の規制当局からも承認は得られておらず、その安全性および有効性はまだ確立されていません。HIV または AIDS に治療法はありません。

ギリアド・サイエンシズについて

ギリアド・サイエンシズは、医療ニーズがまだ十分に満たされない分野において、革新的な治療を創出、開発、製品化するバイオファーマ企業です。会社の使命は、生命を脅かす病を抱える世界中の患者さんのために医療を向上させることです。カリフォルニア州フォスターシティに本社を置き、世界 35 カ国以上で事業を行っています。

ギリアドは 30 年間にわたり、HIV 領域のイノベーターとして、HIV 感染症の治療、予防と治癒に向けた研究を行ってきました。世界には現在、1,200 万人以上の HIV 感染者がギリアド社またはそのジェネリック医薬品製造パートナーが提供する抗レトロウイルス剤を服用しています。

ギリアド・サイエンシズに関する詳細は、www.gilead.com をご覧ください。

将来予想に関する記述

本プレスリリースは、1995 年米国民事証券訴訟改革法（Private Securities Litigation Reform Act of 1995）で定義される「将来予測に関する記述」に該当し、いくつかのリスク、不確定要素、およびその他の要因を含む場合があります。これには、GS-6207 に関する進行中の試験や追加試験で好ましくない結果が得られる可能性などがあります。歴史的事実以外の全ての記述は、将来予想に関する記述とみなしてください。これらのリスク、不確定要素、およびその他の要因により、実際の結果が「将来予想に関する記述」と著しく異なったものとなる可能性があります。将来予想に関する記述のみに依拠することはお控えください。これらのリスクやその他のリスクについては、米国証券取引委員会に提出している、2019 年 3 月 31 日を期末とするギリアド社四半期報告書（フォーム 10-Q）で詳細に説明しています。将来予想に関する記述は全て、ギリアドが現在入手できる情報に基づいており、ギリアドは将来予想に関する記述を更新する義務を負いません。

###

ギリアドおよびギリアドのロゴは、ギリアド・サイエンシズ（Gilead Sciences, Inc.）またはその関連会社の登録商標です。