

<報道関係各位>

2020年6月4日
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、2020年6月4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。

**フィルゴチニブが関節リウマチ対象の
FINCH 1 および FINCH 3 試験で 52 週にわたり
持続的な有効性と一貫した安全性プロファイルを示す
— 第Ⅲ相 FINCH 試験および第Ⅱ相 DARWIN 試験データに基づく
安全性に関する統合解析結果はフィルゴチニブの関節リウマチにおける
長期安全性プロファイルを示す —
— 2020 年 EULAR 欧州リウマチ学会で発表 —**

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」）およびガラパゴス NV（本社：ベルギーメヘレン、ユーロネクストおよびナスダック：GLDP、以下「ガラパゴス」）は6月4日、中等度から重度の活動性関節リウマチの成人患者を対象に、開発段階にある経口投与の選択的 JAK1 阻害剤フィルゴチニブを評価する第Ⅲ相 FINCH 1 および FINCH 3 試験の 52 週時の詳細データを発表しました。同データは、幅広いリウマチ患者集団において、フィルゴチニブの 52 週にわたる持続的な有効性と一貫した安全性プロファイルを示しました。これらのデータを含め、フィルゴチニブの関節リウマチに対する効果を報告する抄録 15 件が 2020 年 EULAR 欧州リウマチ学会（European League Against Rheumatism, EULAR, European E-Congress of Rheumatology, 2020）で発表される予定です。

ギリアドの炎症性疾患部門シニア・バイス・プレジデントであるマーク・ジェノヴェーゼ（Mark Genovese, MD）は、「関節リウマチ患者さんの多くは、日常生活に影響を及ぼすような症状に苦しんでいます。ギリアドは、患者さんの生活を大きく改善する効果的で安全な治療選択肢の開発に尽力しています。今回のデータは、フィルゴチニブが幅広い関節リウマチ患者さんに有益な治療薬候補であることを裏付けるエビデンスをさらに強化するものです。」と述べています。

ガラパゴスのチーフ・メディカル・オフィサーであるワリド・アビサーブ（Walid Abi-Saab, MD）は、「既に 4,554 患者年相当のデータが得られている FINCH と DARWIN 試験は、フィルゴチニブが一貫した有効性と安全性を有し、関節リウマチ患者さんの症状管理に寄与する可能性があることを引き続き示しています。」と述べています。

FINCH 1 試験：メトトレキサートが効果不十分な患者対象の第Ⅲ相臨床試験の 52 週間データ（ポスター#0198）¹

FINCH 1 試験では、メトトレキサートで十分な効果を得られなかった中等度から重度の活動性関節リウマチ患者を対象に、安定した用量のメトトレキサートと併用した場合のフィルゴチニブの効果をプラセボまたはアダリムマブと比較して評価しました。患者は、1日1回投与のフィルゴチニブ 200 mg 群（475 人）、1日1回投与のフィルゴチニブ 100 mg 群（480 人）、週2回投与のアダリムマブ 40 mg 群（325 人）、または同用法・用量のプラセボ群（475 人）に無作為に割り付けられました。以前、発表しました通り、フィルゴチニブ 200 mg 群は、主要評価項目であるプラセボ群と比較した場合の 12 週時 ACR20（米国リウマチ学会（ACR）による指標、圧痛関節数および腫脹関節数の 20%以上改善）改善率を達成しました。フィルゴチニブは、副次評価項目である関節リウマチの徴候や症状、機能障害および関節破壊に関する項目において、プラセボに比べより高い効果を示しました。

FINCH 1 試験では、被験者の大多数（80.7%、1,417/1,755 人）が治験薬の 52 週間投与を完了しました。フィルゴチニブの両用量は、主要評価項目および副次評価項目において 52 週時まで持続的な有効性を示しました。また、フィルゴチニブ 200 mg 群は、52 週時に低疾患活動性（DAS28（CRP）3.2 以下）および臨床的寛解（DAS28（CRP）2.6 未満）をアダリムマブ群に比べより高い比率で達成しました（名目上 $p < 0.05$ ）。寛解の達成率について、CDAI ≤ 2.8 および Boolean 寛解基準を用いた場合も、同群はアダリムマブ群に比べ名目上有意に高い結果でした（名目上 $p < 0.05$ ）。フィルゴチニブ 200 mg 群は、52 週時に健康評価質問票（Health Assessment Questionnaire-Disability Index）スコアがベースライン時点からアダリムマブ群に比べより大きく減少しました（名目上 $p < 0.05$ ）。フィルゴチニブ 100 mg 群は、これらの評価項目における反応率は、アダリムマブ群と数値的に同程度でした。

本試験で、フィルゴチニブ 200 mg 群およびフィルゴチニブ 100 mg 群はともに、52 週にわたり一貫した安全性プロファイルを示し、新たな安全性シグナルは認められませんでした。24 週までに死亡例は 5 例報告され、そのうち 2 例はプラセボ群、2 例はフィルゴチニブ 200 mg 群および 1 例はフィルゴチニブ 100 mg 群の患者でした。24 週時から 52 週時までに死亡例は 4 例報告され、そのうち 2 例はフィルゴチニブ 200 mg 群、1 例はアダリムマブ群および 1 例はプラセボ群の患者でした。特に注目すべき有害事象（重篤な感染症、帯状疱疹、静脈血栓塞栓症、主要心血管イベント [MACE]）の発現率は、すべての投与群で低頻度および同程度でした。帯状疱疹の発現は、すべての投与群で観察され、その頻度はフィルゴチニブ 100 mg 群に比べフィルゴチニブ 200 mg 群で高頻度でした。

FINCH 3試験：メトトレキサートによる治療歴がない患者対象の第III相臨床試験の52週間データ（ポスター#0158）²

FINCH 3試験では、メトトレキサートによる治療歴がない患者を対象にフィルゴチニブの効果を検証しました。患者は、フィルゴチニブ 200 mg+メトトレキサート群（416人）、フィルゴチニブ 100 mg+メトトレキサート群（207人）、フィルゴチニブ 200 mg単独群（210人）およびメトトレキサート単独群（416人）に無作為に割り付けられました。以前、発表しました通り、フィルゴチニブ 200 mg+メトトレキサ

ート群は、主要評価項目であるメトトレキサート単独群と比べた場合の24週時ACR20改善率を達成しました ($p < 0.001$)。

FINCH 3試験では、被験者の大多数 (78.1%、975/1,249人) が治験薬の52週間投与を完了しました。本解析では、すべての投与群が52週にわたり臨床的反応、身体機能およびX線所見の進行において持続的な有効性を示しました。フィルゴチニブ 200 mg+メトトレキサート群、フィルゴチニブ 100 mg+メトトレキサート群およびフィルゴチニブ 200 mg単独群は、52週時にメトトレキサート単独群に比べより高い比率でACR20改善 (名目上、それぞれ $p < 0.001$ 、 $p < 0.01$ および $p < 0.001$)、ACR50改善 (名目上、それぞれ $p < 0.001$ 、 $p < 0.01$ および $p < 0.01$)、ACR70改善 (名目上、それぞれ $p < 0.001$ 、 $p < 0.05$ 、 $p < 0.01$) および寛解 (すべての投与群で名目上 $p < 0.001$) を達成しました。フィルゴチニブ 200 mg+メトトレキサート群 (名目上 $p < 0.001$) およびフィルゴチニブ 200 mg単独群 (名目上 $p < 0.05$) は、52週時に身体機能がメトトレキサート単独群に比べ有意に改善しました (健康評価質問票 (Heath Assessment Questionnaire-Disability Index) スコアのベースライン時点からの減少を指標とする)。フィルゴチニブ 200 mg+メトトレキサート群 (名目上 $p < 0.001$)、フィルゴチニブ 100 mg+メトトレキサート群 (名目上 $p < 0.05$) およびフィルゴチニブ 200 mg単独群 (名目上 $p < 0.05$) は、52週時にメトトレキサート単独群に比べ関節破壊の進行が少ないことが認められました。

本試験では、フィルゴチニブは単独として、またはメトトレキサートとの併用療法として一貫した安全性プロファイルを示し、新たな安全性シグナルは認められませんでした。死亡例は、フィルゴチニブ 200 mg+メトトレキサート群で3例、フィルゴチニブ 100 mg+メトトレキサート群で1例報告されました。感染症、重篤な感染症および帯状疱疹を含む特に注目すべき有害事象は、各フィルゴチニブ投与群およびメトトレキサート単独群で同程度に発現しました。静脈血栓塞栓症は、いずれのフィルゴチニブ投与群においても発現しませんでした。

同学会では、FINCH 1およびFINCH 3試験の52週間データに加え、関節リウマチの治療薬としてのフィルゴチニブの安全性および有効性に関する新たな解析を発表する予定です。

FINCH 2：生物学的疾患修飾性抗リウマチ薬 (biologic DMARD) で効果不十分な患者対象のサブグループ解析 (ポスター#0204) ³

関節リウマチ患者の多くは、既存の生物学的疾患修飾性抗リウマチ薬で十分な効果が得られません。本サブグループ解析では、そのような患者のフィルゴチニブに対する24週時の臨床的反応を指標として解析しました。過去に投与された生物学的疾患修飾性抗リウマチ薬の数やIL-6またはTNF阻害薬による治療歴の有無にかかわらず、各フィルゴチニブ投与群は一貫してプラセボ群に比べ高い比率で低疾患活動性および寛解を達成しました。フィルゴチニブ 200mg群では、その低疾患活動性の達成率はプラセボ群に比べ統計学的に有意なものでした (名目上 $p < 0.001$)。

有害事象に関するサブグループ解析の結果は、本試験の全体集団の結果と一貫していました。

第III相FINCH試験および第II相DARWIN試験の安全性に関する統合解析（ポスター#0202）⁴

第III相FINCH試験および第II相DARWIN試験の合計7試験のデータに基づき行われた安全性に関する統合解析結果では、関節リウマチに対するフィルゴチニブの一貫した安全性プロファイルがさらに裏付けられ、新たな安全性シグナルは特定されませんでした。全試験で、合計3,827例の関節リウマチ患者が合計4,544.5患者年にわたりフィルゴチニブ投与を1回以上受けました。

フィルゴチニブ投与患者における重篤な有害事象または試験治療下での致死的な有害事象の曝露量で調整した発現率は、プラセボ、アダリムマブ、またはメトトレキサート投与患者と同程度でした。用量依存的な影響は認められませんでした。フィルゴチニブ投与患者における感染症および帯状疱疹の曝露量で調整した発現率は、アダリムマブおよびメトトレキサート投与患者と類似していました。帯状疱疹発現例のほとんどは軽度から中等度であり、重度ではありませんでした。主要心血管イベント（MACE）および静脈血栓塞栓症の発現頻度は、プラセボ投与患者に比べフィルゴチニブ投与患者で低いことが認められました。本統合解析では、フィルゴチニブの高い忍容性が示され、新たな安全性シグナルは特定されませんでした。

フィルゴチニブは有効性と安全性が確立していない開発中の治療薬です。フィルゴチニブの使用は、いずれの規制当局にも承認されていません。

フィルゴチニブに関する提携について⁵

ギリアドとガラパゴスは、関節リウマチを対象としたフィルゴチニブやその他炎症性疾患の開発と商業化に関するグローバルな提携契約を締結しています。両社は、複数の炎症性疾患を対象としたフィルゴチニブの臨床試験を進めており、関節リウマチ対象の第III相FINCH試験、潰瘍性大腸炎対象の第III相SELECTION試験、クローン病対象の第III相DIVERSITY試験、乾癬性関節炎対象の第III相PENGUIN試験およびぶどう膜炎ならびに小腸のクローン病または瘻孔を伴うクローン病対象の第II相試験を含みます。フィルゴチニブの試験に関する詳細については、www.clinicaltrials.gov、ご確認ください。

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 か国以上で事業を行っています。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。

ガラパゴスについて

ガラパゴス（ユーロネクストおよびナスダック：GLPG）は、新たな作用機序を有する低分子化合物による医薬品の創薬と開発を行っており、そのうち 3 つの治療薬では患者への投与で有望な結果が得られており、現在複数の疾患を対象に後期開発段階にあります。パイプランは、炎症性疾患、線維症、関節炎、およびその他の適応で、創薬プログラムから第III相段階にあるものまで多岐にわたります。その目標は、革新的医薬品の創薬、開発、お

よび商業化を主眼とした世界有数のバイオ医薬品企業となることです。詳細については、www.glpq.com をご覧ください。

ギリアドの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、いくつかのリスクや不確定要素などの要因に左右される場合があります。フィルゴチニブの継続中または追加の臨床試験で好ましくない結果が得られる可能性、またこれらの試験の一つ以上が現在予定している期間内に完了できない可能性があります。さらに、ギリアドおよびガラパゴスがフィルゴチニブの開発を中止する戦略的判断を下し、その結果フィルゴチニブが商業化に至らない可能性があります。過去の事実以外全ての記述は、将来予想に関する記述とみなすことができます。これらのリスクや不確定要素、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のないようご注意ください。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（U.S. Securities and Exchange Commission : SEC）に提出している、2020 年 3 月 31 日を四半期末とするギリアド四半期報告書（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すべて、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。

ガラパゴスの将来予想に関する記述

本プレスリリースには、ガラパゴスの将来予想に関する記述を含みます。このような記述にはガラパゴスの戦略的目標、フィルゴチニブの作用機序、安全性および有効性に関する可能性、フィルゴチニブの臨床試験の実施時期に関する見込み、ならびにこのような臨床試験の進捗と結果などが含まれます。将来予想に関する記述は、将来の業績を保証するものではないことに留意してください。将来予想に関する記述には、既知・未知のリスク、不確定要素などの要因が含まれており、実際の成果、財務状況、および財務流動性、ガラパゴスの業績・実績または業界実績は、将来予想で表明または暗示された過去または将来の成果、財務状況および財務流動性、業績または実績と大きく異なる可能性があります。また、ガラパゴスの成果、業績、財務状況および財務流動性、ならびに同社が活動する業界における開発状況が将来予想に関する記述と矛盾しない場合であっても、将来の結果や開発を予測するものではありません。相違をもたらす可能性がある要因には、開発競争、臨床試験および製品開発活動、承認に必要な要件に関連した固有の不確定要素（現在進行中および計画中の臨床研究プログラムのデータが安全性、有効性およびその他理由により承認あるいは開発続行の根拠とならない場合を含む）、ガラパゴスが第三者（フィルゴチニブの開発・商業化のパートナーであるギリアド含む）との提携に依存していること、およびガラパゴスの製品の商業的可能性などがあります。上記のリスク、不確定要素、およびその他リスクの一覧と詳細は、ガラパゴスの最新のフォーム 20-F の年次報告書をはじめとする米国証券取引委員会（Securities and Exchange Commission : SEC）に提出する報告書、ならびに今後の SEC への届出や報告などをご参照ください。これらの不確定要素があるため、このような将来予想に関する記述に全面的に依拠することはお控えください。

将来予想に関する記述は、あくまでも公表日現在における予想です。本プレスリリースでの将来予想に関する記述の根拠となり、将来予想の記述と実際の結果が異なる可能性に影響を及ぼすおそれのある出来事、条件または状況のいかなる変化に関しても、法令や規制に定められた場合を除き、本リリースの将来予想に関する記述を更新する義務を負いません。

###

注)

¹Combe, B et al.、FINCH1 試験 52 週時の結果：メトトレキサートで効果不十分な患者におけるフィルゴチニブの有効性と安全性、2020 年 EULAR 欧州リウマチ学会で発表予定の抄録

²Westhovens, R et al.、FINCH3 試験 52 週時の結果：メトトレキサートの治療歴がない関節リウマチ患者におけるフィルゴチニブの有効性と安全性、2020 年 EULAR 欧州リウマチ学会で発表予定の抄録

³Gottenberg, J-E et al.、フィルゴチニブ第Ⅲ相試験における生物学的疾患修飾性抗リウマチ薬で効果不十分な患者の低疾患活動性および寛解に関するサブグループ解析、2020 年 EULAR 欧州リウマチ学会で発表予定の抄録

⁴Genovese, M C et al.、関節リウマチ対象のフィルゴチニブ試験 7 試験の安全性に関する統合解析、2020 年 EULAR 欧州リウマチ学会で発表予定の抄録

⁵ ギリアドおよびガラパゴスによるフィルゴチニブの臨床試験に関する詳細：FINCH1 試験 ([NCT02889796](#)) ; FINCH2 試験 ([NCT02873936](#)) ; FINCH3 試験 ([NCT02886728](#)) ; SELECTION 試験 ([NCT02914522](#)) ; DIVERSITY 試験 ([NCT02914561](#)) ; PENGUIN1 試験 ([NCT04115748](#)) ; PENGUIN2 試験 ([NCT04115839](#))