

2021年12月13日

日本イーライリリー株式会社

〒651-0086
神戸市中央区磯上通 5-1-28
www.lilly.co.jp

EL21-68

<新発売>

抗悪性腫瘍剤「レットヴィモ®カプセル 40mg、同カプセル 80mg」 ～RET融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌に新たなチロシンキナーゼ阻害剤～

¹RET : rearranged during transfection

日本イーライリリー株式会社(本社:兵庫県神戸市、代表取締役社長:シモーネ・トムセン、以下、日本イーライリリー)は「RET融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌」に対する治療薬として抗悪性腫瘍剤「レットヴィモ®カプセル 40mg、同カプセル 80mg」(一般名 セルペルカチニブ、以下、レットヴィモ)を2021年12月13日に発売したことをお知らせいたします。

レットヴィモは、RET融合遺伝子陽性非小細胞肺癌に対して世界で初めて承認された、RETタンパク質のキナーゼ活性を選択的に阻害する低分子チロシンキナーゼ阻害剤です。RETの活性化は、RETのキナーゼドメインとパートナータンパク(CCDC6、KIF5B、NCOA4など)の二量体化ドメインが融合することで、リガンドに依存せず恒常的にキナーゼが活性化した状態になる染色体再構成(RET融合遺伝子)により起こると考えられています。レットヴィモは、活性化されたRETを選択的に阻害することで、腫瘍の増殖を阻害すると考えられています。

日本イーライリリーの執行役員でオンコロジー事業本部 事業本部長の小嶋 毅彦はレットヴィモの発売について次のように述べています。「RET融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌に対する治療薬としてレットヴィモが発売されました。非小細胞肺癌の新たな治療選択肢として患者さんに届けられることを大変うれしく思います。今後、肺癌の患者さんやご家族に希望をもたらすものとなるよう、私たちは適正使用の推進に全力を尽くしてまいります」

<参考資料>

販売名:	レットヴィモ®カプセル 40mg、同カプセル 80mg
一般名:	セルペルカチニブ
効能・効果:	RET融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌
用法・用量:	非小細胞肺癌における用法・用量は通常、成人にはセルペルカチニブとして1回 160mgを1日2回経口投与します。
薬価:	40mg 1カプセル 3,680.00円 80mg 1カプセル 6,984.50円
製造販売承認取得日:	2021年9月27日
薬価基準収載日:	2021年11月25日
発売日:	2021年12月13日

製品写真



承認の根拠となった国際共同第 I/II 相 試験(LIBRETTO-001 試験)※

①化学療法歴のある *RET* 融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌患者 134 例(日本人患者 25 例を含む)および②化学療法歴のない *RET* 融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の非小細胞肺癌患者 35 例(日本人患者 1 例を含む)に本剤 1 回 160mg を 1 日 2 回経口投与しました。主要評価項目である RECIST ver. 1.1 に基づく独立評価委員会判定による奏効率は、それぞれ①55.2%(95%信頼区間:46.4-63.8) および②71.4%(95%信頼区間:53.7-85.4)でした。

安全性評価対象 180 例に認められた主な副作用は、口内乾燥(42.8%)、ALT 増加(37.2%)、AST 増加(35.0%)、高血圧(29.4%)、浮腫(26.1%)などでした。

※レットヴィモ添付文書より

レットヴィモ®はイーライリリー・アンド・カンパニーおよびその子会社または関連会社が所有するかまたはライセンスを受けた登録商標です。

肺がんについて

日本における 2018 年の肺がんの罹患全国推定値は、122,825 例です。また、2019 年度の肺がんによる死亡推定数は、75,394 例で、がん全体の中で、1 位(肺がん、男女計)です。※

※国立がん研究センターがん情報サービス「がん登録・統計」 https://ganjoho.jp/reg_stat/index.html

*RET*遺伝子に起因する癌について

融合遺伝子と活性化変異を含む *RET* キナーゼの遺伝子異常は、過剰な *RET* シグナル伝達と制御不能な細胞増殖を引き起こします。*RET* 融合遺伝子は、非小細胞肺癌の約 2%と推定されています。*RET* 融合遺伝子陽性の癌では、癌細胞の増殖と生存が *RET* キナーゼの活性化に依存します。これは「がん遺伝子依存」と呼ばれ、*RET* 遺伝子を標的とする低分子阻害薬は、これらの癌に高い抗腫瘍活性を示します。*RET* 遺伝子のドライバー変異は基本的には、他の発癌ドライバー遺伝子異常とは相互排他的です。

日本イーライリリーについて

日本イーライリリー株式会社は、米国イーライリリー・アンド・カンパニーの日本法人です。人々がより長く、より健康で、充実した生活を実現できるよう、革新的な医薬品の開発・製造・輸入・販売を通じ、がん、糖尿病、筋骨格系疾患、中枢神経系疾患、自己免疫疾患、成長障害、疼痛などの領域で日本の医療に貢献しています。詳細はウェブサイトをご覧ください。 <https://www.lilly.co.jp>