

# 世界をリードするGPCR創薬

Sosei Group Corporation | 投資家向けオンライン説明会

# 目次

1

製薬産業の全体像

2

会社概要とGPCR創薬

3

2020年度業績と内部成長プラン

4

戦略的成長プランと2021年以降のビジョン

5

補足資料

注: 本資料は、当社に関する情報の提供を目的とするためのものであり、投資勧誘を目的に作成されたものではありません。また、本資料に記載された内容は、資料作成時点での当社の判断であり、その情報の正確性を保証するものではありません。投資を行なうに際しては、投資家ご自身の判断で行なうようお願いいたします。

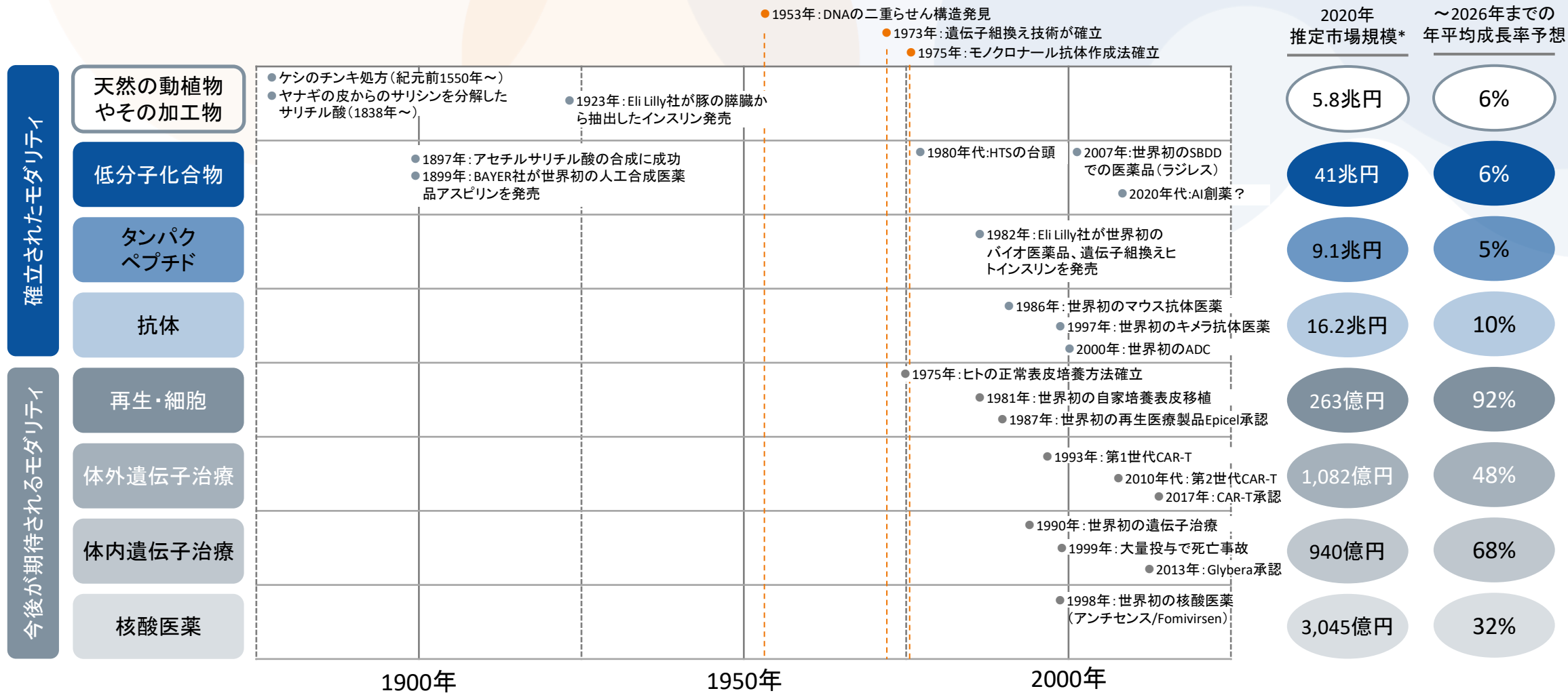


1

# 製薬産業の全体像

# 主なモダリティにおける創薬の歴史

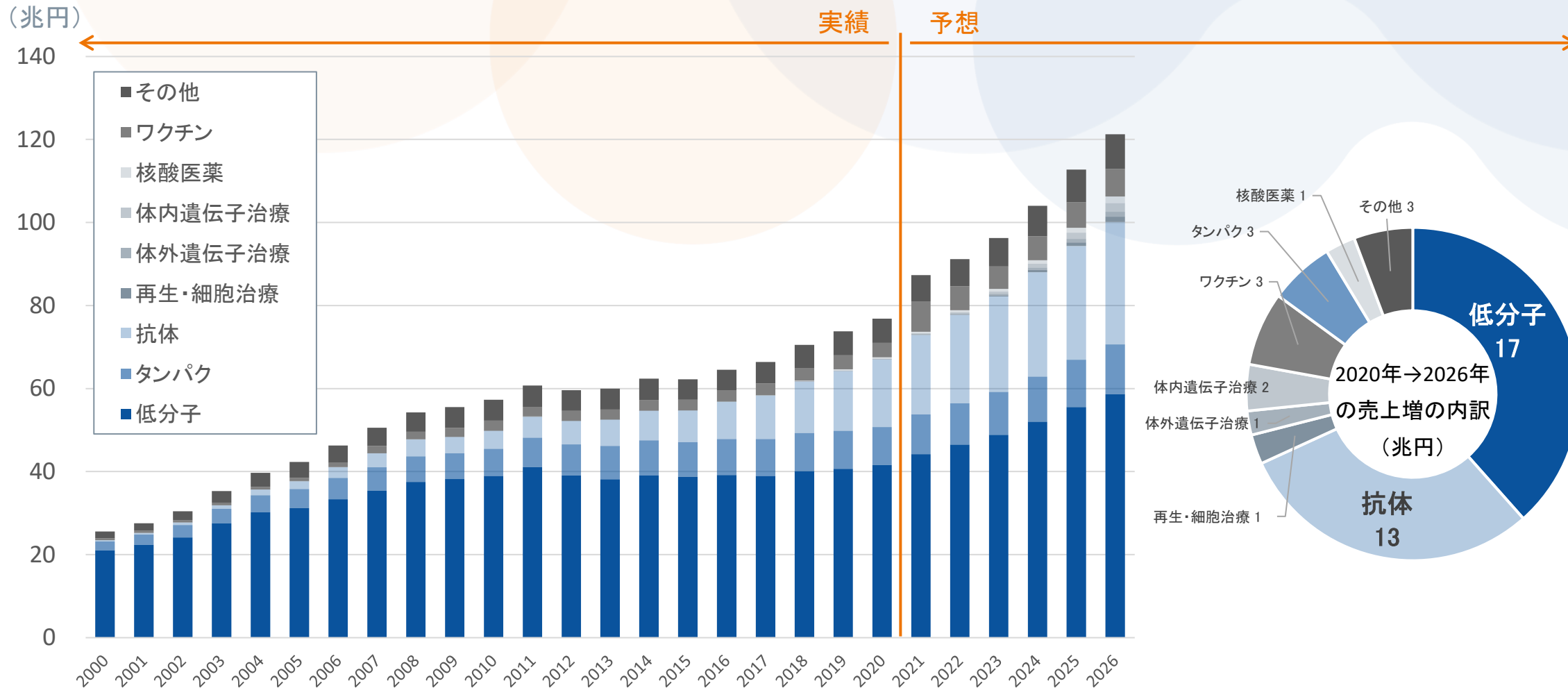
低分子は医薬品産業で最も規模が大きく、確立された創薬モダリティ



\*推定市場規模は個別の製品売上高の積算で算出され、製品売上高が公開されていない製品は含まれないため、実際の市場規模よりも小さい可能性がある点に留意  
出所: Evaluate Pharma等より当社作成

# “モダリティ別”の医薬品売上高の実績と予想

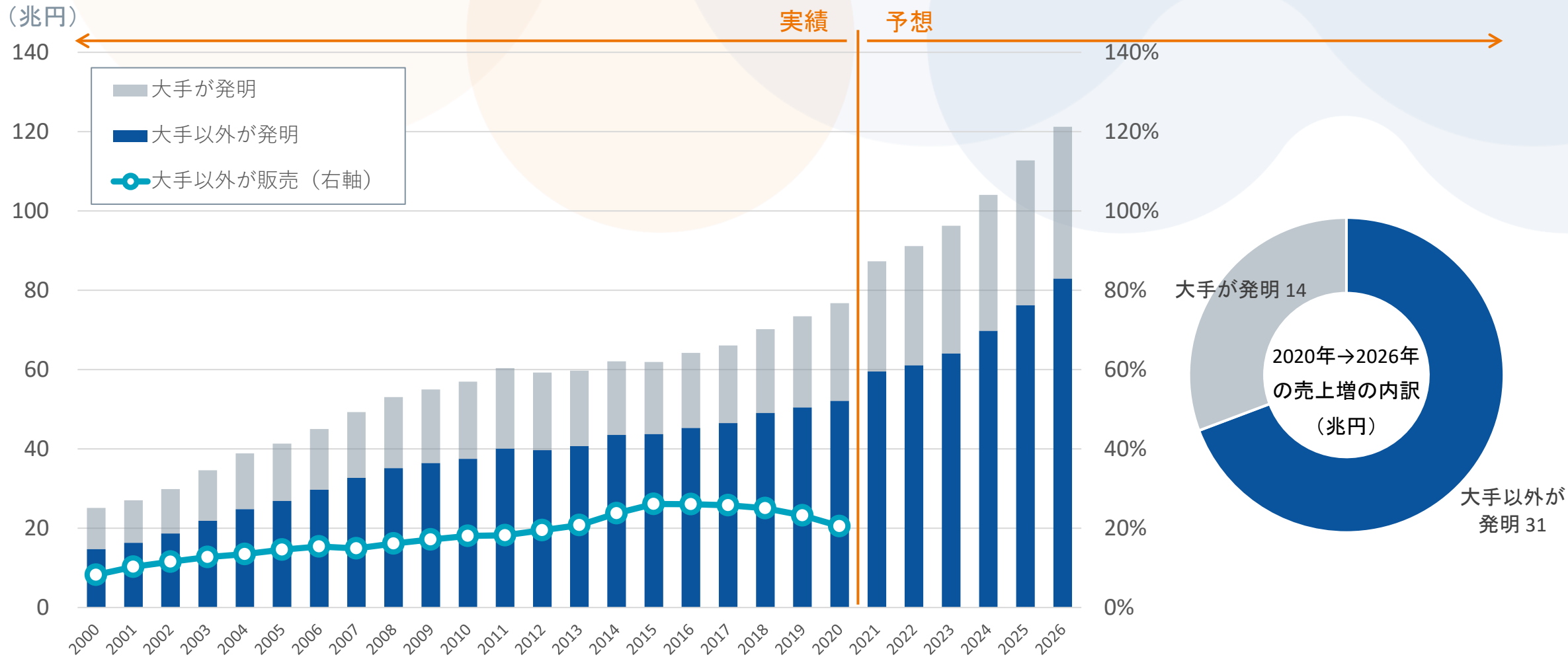
2026年までに低分子は17兆円、抗体は13兆円の市場増が世界で期待されている



出所: Evaluate Pharmaより当社作成

# “発明者別”の医薬品の売上高の実績と予想

ベンチャーは医薬品の約7割の“発明者”だが、販売では約2割に留まる

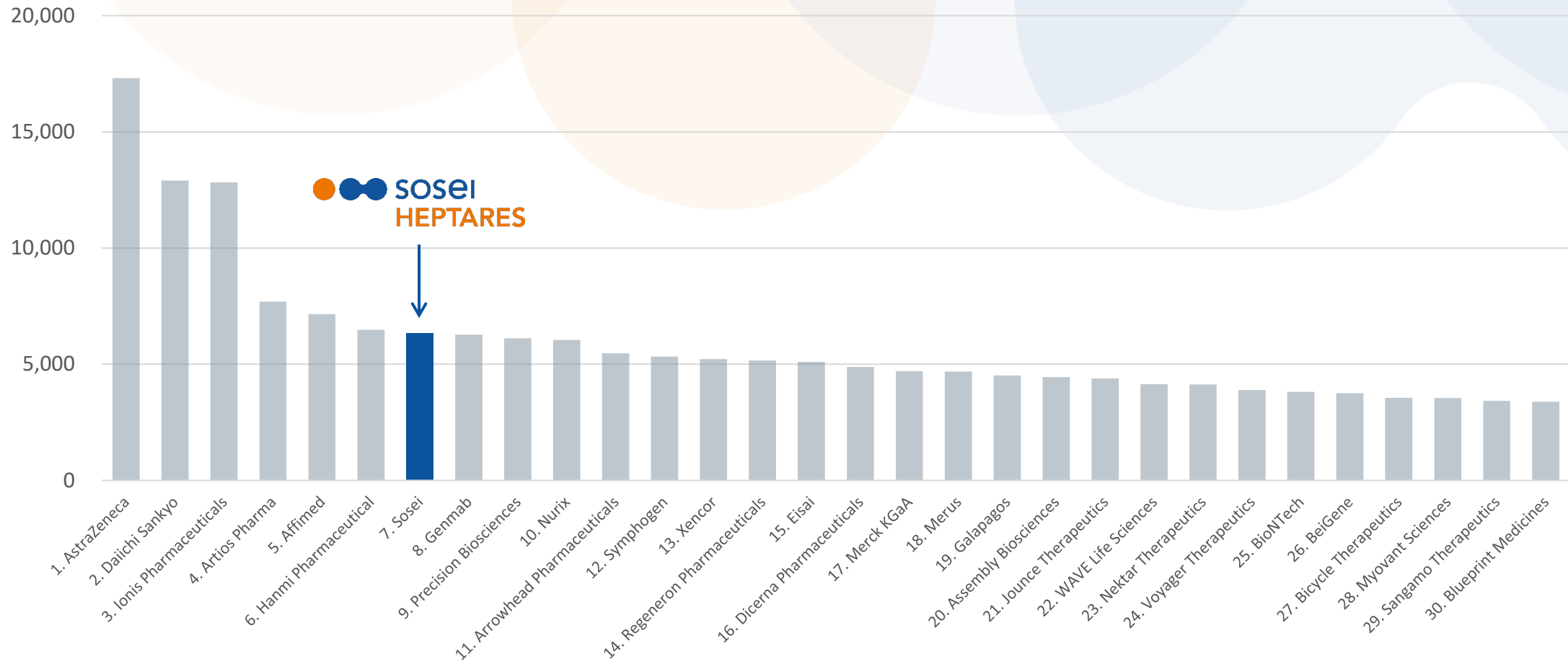


\*大手はEvaluate社の企業の定義で“Global Majors (Pharma)”、“Regional Major (Pharma)”、“Generic”を合算  
出所: Evaluate Pharmaより当社作成

# 世界の製薬・バイオ企業のライセンス金額トップ30

2015年以降のライセンス金額ランキングで、当社は世界7位に位置付けられている

(百万ドル)



出所: Evaluate Pharma, 2015年-2020年のデータより当社作成



2

## 会社概要とGPCR創薬



# そせいグループの沿革

国内開発に加えて、海外の創薬ベンチャーの買収により成長中

CEO田村により設立



英国のバイオ医薬品企業  
アラキス社を買収し、COPD  
治療薬をパイプラインに追加



1990

2004

2005

2015

現在



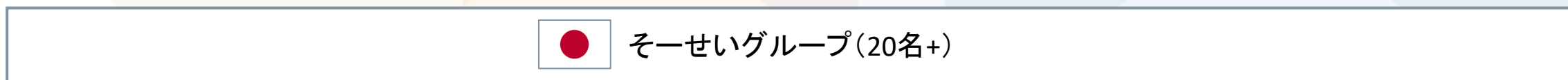
東京証券取引所マザーズに上場  
(証券コード:4565)



GPCR創薬にフォーカスした  
英国のバイオ医薬品企業  
ヘプタレス社を買収

# 日本と英国に拠点を持つバイオベンチャー

特に2015年に買収したHeptares社により成長を加速



Heptares社

**GPCR中心の創薬に特化**

- 150+** 従業員数
- 300+** 構造解析数
- +15** 提携契約
- +700M** 提携による収益<sup>1</sup>
- +7Bn** デール総額<sup>2</sup>

(株)そーせい

**国内での開発・販売に特化**

- 15+** 従業員数
- 2-3** 開発可能数/年
- 2** 承認実績

自社で前臨床～臨床試験(Phase1)まで進めた後にパートナーに導出

開発品を導入し日本で後期開発

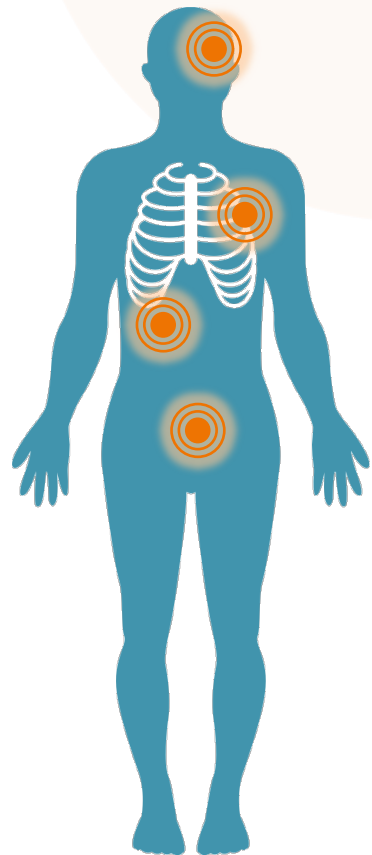
<sup>1</sup>2005年から2020年の間に締結したすべての提携契約(既に終了している契約を含む)において受領した一時金、マイルストン、ロイヤリティ、研究資金を含む。

<sup>2</sup>2005年から2020年までの(終了・活動停止中の提携を含む)すべての提携が対象。

出所: 当社作成

# GPCR (Gタンパク共役型受容体)とは何か？

現在までの創薬の歴史で最も巨大な創薬ターゲット群だが、未だに多くが未開拓



約400種類  
GPCR  
タンパク質

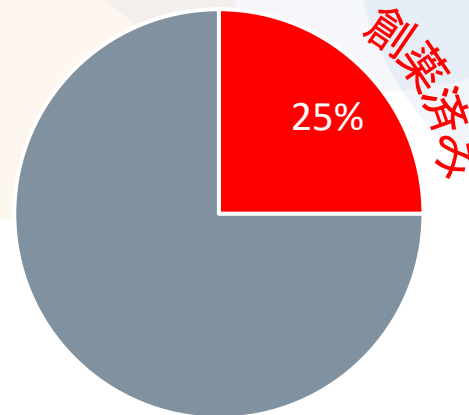
神経系

消化器系

がん免疫

希少/特殊

これまで

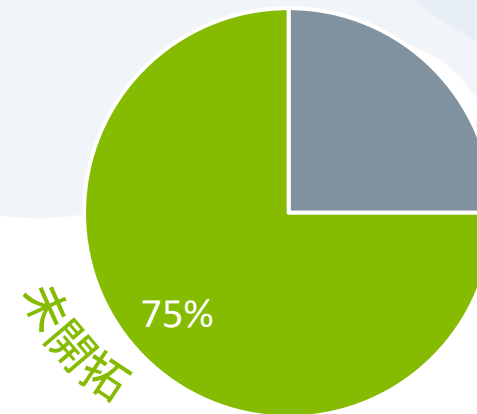


GPCRを標的としたブロックバスターの例



2018年に約20兆円の売上高\*

これから



ファースト・イン・クラスのブロックバスターを狙う

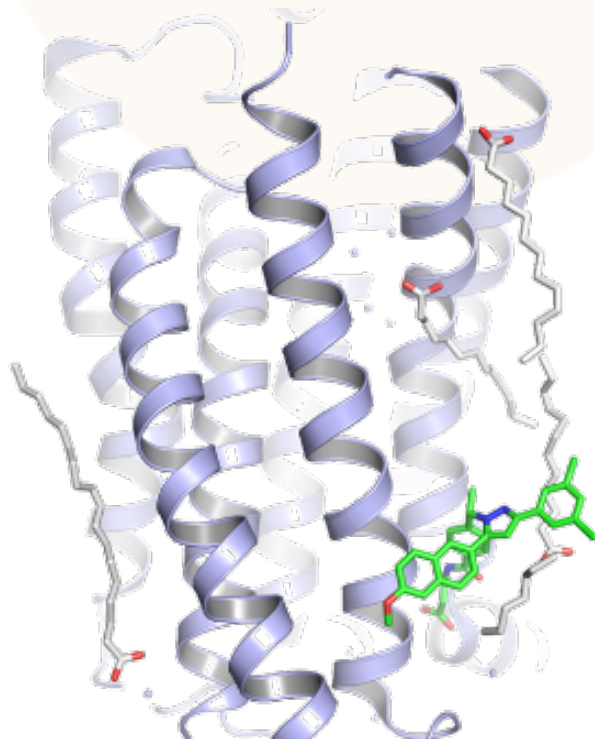


\*Pharmacogenomics of GPCR Drug Targets

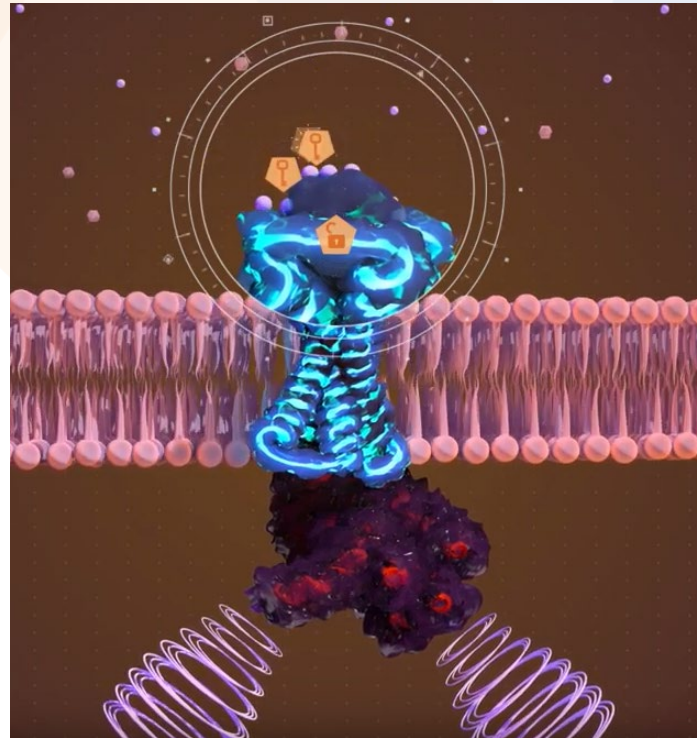
出所: "Unexplored opportunities in the druggable human genome", Nature Reviews, 2016; "Trends in GPCR in Drug Discovery – new agents, targets and indications", Nature Reviews, 2017;等より当社作成

# StaR<sup>®</sup> 技術\*がより高度なGPCR創薬を実現

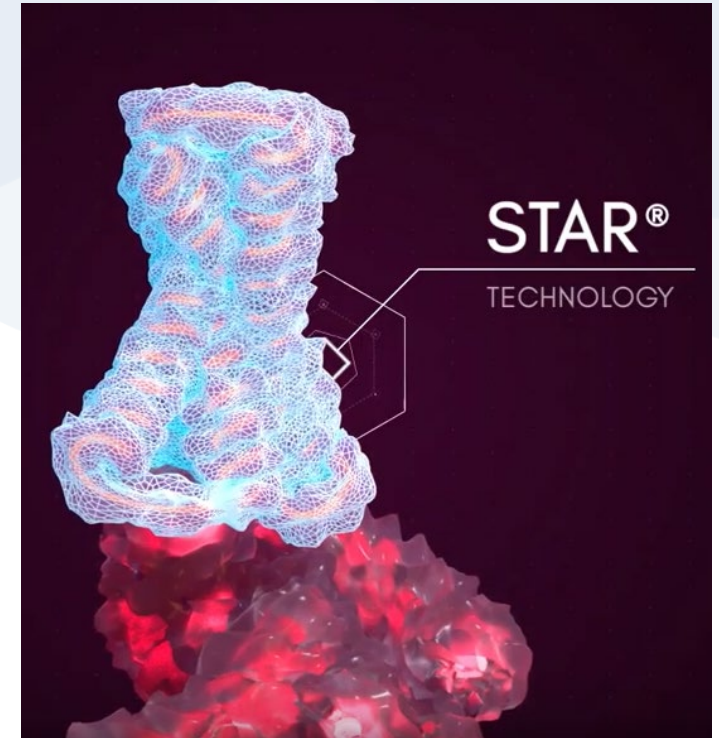
GPCRの構造を知ることで、より優れた高度な創薬が可能に



GPCRは複数の疾患領域に関わっており、幅広い治療の可能性



しかし、GPCRの構造が不安定であるという性質から創薬が困難

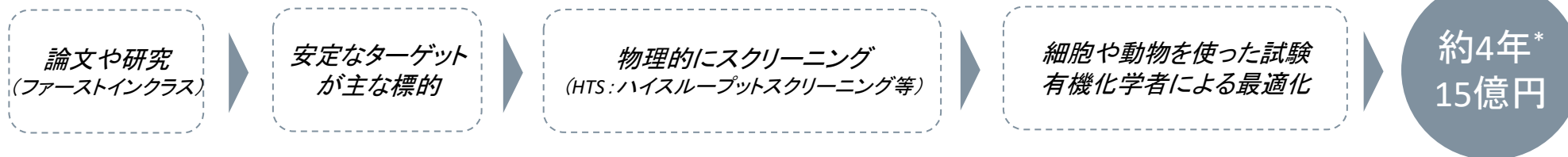
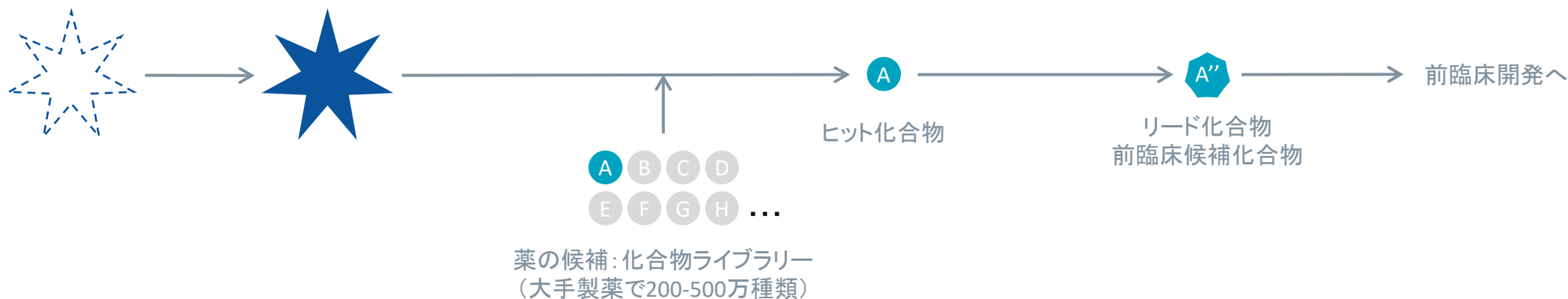
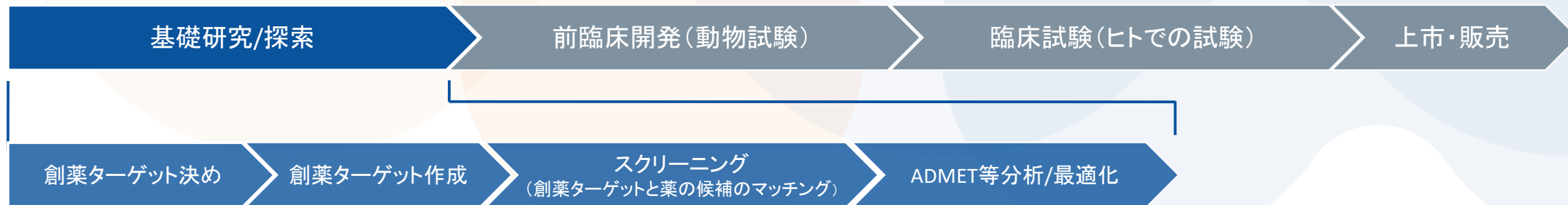


商用規模でGPCRを安定化し、創薬および初期開発に活用

\*Stabilized receptor technology(タンパク質安定化技術)  
出所: 当社作成

# そもそも薬はどうやって見つけるのか？

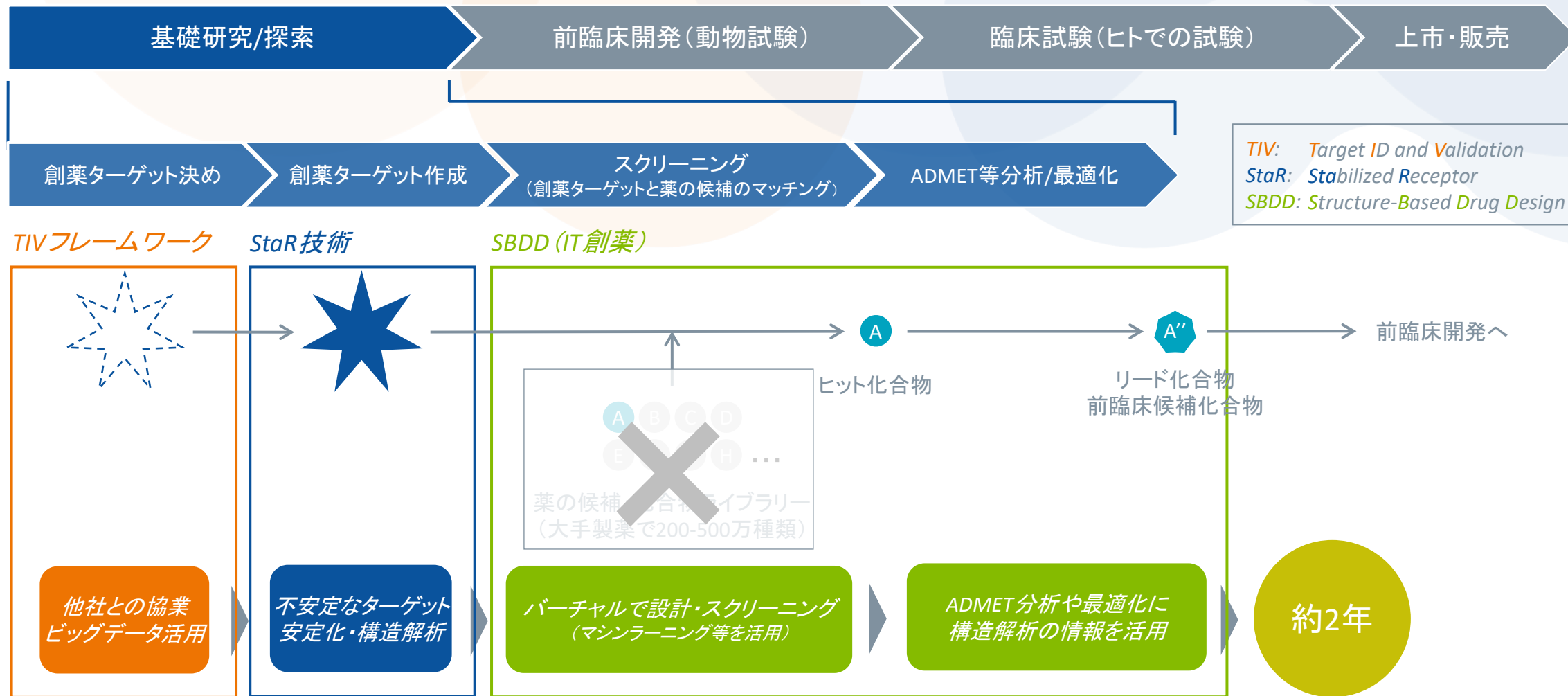
低分子を例にした伝統的な創薬には、4年間に亘り15億円程度が必要



\*NATURE REVIEWS Drug Discovery(MARCH 2010)  
出所: 当社作成

# 当社はどうやって薬を見つけているのか？

StaR技術による構造解析をコアに、多くの創薬プロセスをITにより効率化





3

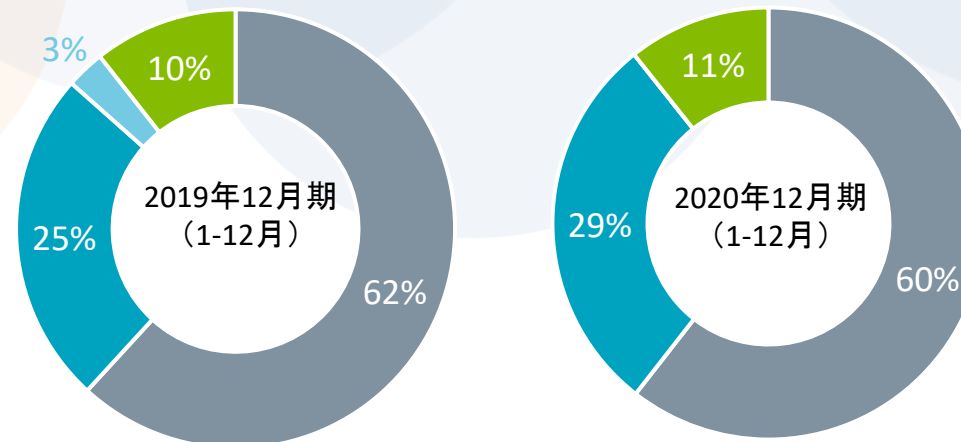
## 2020年度業績と 内部成長プラン

# 創薬提携と共同投資に注力し、 バランスの取れた売上内訳を実現

## 直近2年の業績(百万円)

	2019年12月期	2020年12月期
売上収益	9,726	8,842
売上原価に係る現金支出	(807)	(607)
研究開発費に係る現金支出	(3,937)	(3,411)
一般管理費に係る現金支出	(2,164)	(1,995)
その他の現金収益	28	75
<b>現金利益</b>	<b>2,846</b>	<b>2,904</b>
非現金支出費用	(2,462)	(1,976)
<b>営業利益</b>	<b>384</b>	<b>928</b>
金融収益(費用)	331	1,050
持分法による投資利益(損失)	(181)	(356)
<b>税引前当期利益</b>	<b>534</b>	<b>1,622</b>
<b>当期利益</b>	<b>1,432</b>	<b>1,479</b>

## 売上収益内訳



	2019年12月期(1-12月)		2020年12月期(1-12月)	
■ マイルストーン	6,013百万円	55.1百万ドル	5,353百万円	50.1百万ドル
■ ロイヤリティ	2,406百万円	22.1百万ドル	2,544百万円	23.8百万ドル
■ 医薬品販売	276百万円	2.5百万ドル	-	-
■ その他	1,031百万円	9.5百万ドル	945百万円	8.9百万ドル

注: 為替レート: 1ドル=106.77円(2020年度)、1ドル=109.03(2019年度)



# 新規プログラムの加速、大手企業との新規提携、 企業価値向上のため投資は小幅増加

## 研究開発費に係る現金支出

## 一般管理費に係る現金支出

2020年度旧予想

4,200百万円～4,700百万円

1,800百万円～2,300百万円

2020年度  
実績

3,411百万円

1,995百万円

- ✓ 提携拡大による自社での支出減少
- ✓ コロナウイルスの影響に合わせ、研究開発費をコントロール

- ✓ 慎重なコストマネジメント
- ✓ 当社株価の減少に伴う英国での社会保険料の減少

2021年度  
予想

4,000百万円～5,000百万円

1,800百万円～2,300百万円

- ✓ M<sub>4</sub> 作動薬プログラムに投資
- ✓ ファーストインクラス探索のためのTIVフレームワークへ投資








- ✓ コンプライアンスおよびガバナンス体制の継続的構築
- ✓ オラクルNetSuite ERPの導入

# 世界をリードするGPCR創薬が牽引する当社の内部成長プラン



内部成長プランの目標をすべて達成

# 2020年にも価値の高い3つの新規提携を実現

提携先	プログラム	疾患領域	契約一時金 / 初期マイルストーン	潜在的取引総額 <sup>1</sup>
	2020年 GPR35作動薬を対象とした研究開発提携およびライセンス契約	消化器疾患、免疫疾患	44百万ドル	4.8億ドル超
	2020年 CGRP拮抗薬を対象とした研究開発提携およびライセンス契約	神経疾患	10百万ドル	3.8億ドル超
	2020年 ライセンスオプションを含む創薬提携 <sup>2</sup>	炎症性疾患および自己免疫	32百万ドル	4億ドル超
	2019年 複数のターゲットを対象とした提携	複数 当面は消化器疾患に注力	26百万ドル	12億ドル超
	2019年 複数のターゲットを対象とした提携	複数	26百万ドル	10億ドル超
	2015年 複数のターゲットを対象とした提携	複数	--	18億ドル超
	2015年 A <sub>2a</sub> 拮抗薬を対象とした研究開発提携およびライセンス契約	がん免疫	10百万ドル	5億ドル超
合計			148百万ドル	59億ドル超

<sup>1</sup> 将来受け取る権利を有するオプション行使料、開発/承認/商業化マイルストーンに加えグローバルなロイヤリティの総額

<sup>2</sup> アッヴィは最大3つのターゲットを追加的に選定できるオプションを有する

# 新たな提携・自社プログラムが加わり、 将来のさらなる提携と企業価値の向上を牽引






■ 提携プログラム  
 ■ 自社開発プログラム  
 ★ 最近返還されたプログラム



20 注: シーブリ®, ウルティプロ®およびエナジア®はノバルティス社の登録商標です。<sup>1</sup>日本でのレビー小体型認知症を対象としたHTL0018318の第II相臨床試験は中止しました。当社グループは、医薬品医療機器総合機構(PMDA)へHTL0018318(あるいは別の新規M1作動薬候補)の新たな治験届を将来再提出する予定です。<sup>2</sup>GLP1拮抗薬のライセンスオプションは、2020年12月31日までに行使されなかったため、現在は自社開発プログラムです。

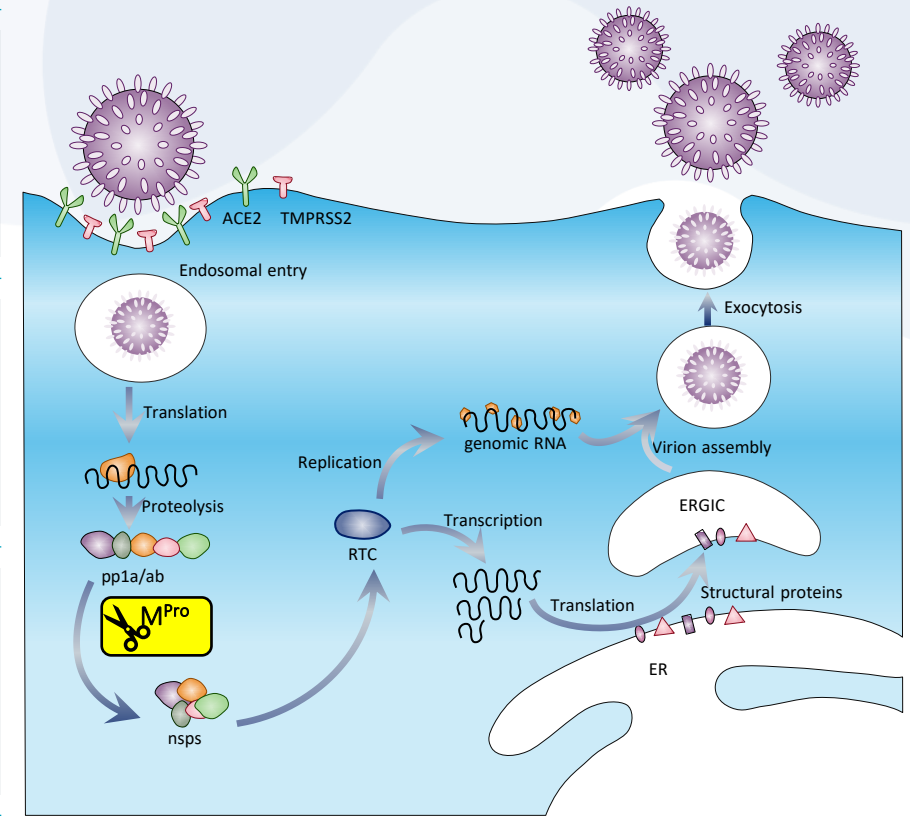
# 他のムスカリンプログラムへの投資を継続しつつ M4作動薬HTL16878への投資を強化

プログラム	化合物	ステージ	FY2021	FY2022	FY2021 予算配分*
M <sub>4</sub> 作動薬	HTL16878	Ph 1	Ph2に向けての準備	Ph2 開始 Ph 2 臨床開発	50% 
M <sub>1</sub> 作動薬	HTL18318	Ph 1	毒性調査 データ解析/ バックアップ化 合物との比較	優先的に開発する M <sub>1</sub> 作動薬プログラムを 2021年末までに決定	25% 
	非開示 (M <sub>1</sub> バックアップ)	前臨床候補選択	前臨床試験		
M <sub>1</sub> / M <sub>4</sub> デュアル作動薬	非開示	前臨床候補選択	前臨床試験		25% 
提携に向けた活動			可能性のある複数の提携 候補先と積極的に交渉	2021年中の 契約締結を目指す	-

注: ムスカリンプログラムの中でも代表的なものに絞って進捗予定を記載  
\*ムスカリンプログラム中での予算配分であり、研究開発費の全体の予算配分とは異なる

# 2020年には当社のSBDDプラットフォームをCOVID-19の研究開発に活用し、強力な抗ウイルス活性を持つ低分子を特定

- ✓ ウィルス複製に不可欠なタンパク質であるSARS-CoV-2 Mプロテアーゼに焦点を当てたプログラム
- ✓ 構造ベースのアプローチにより、SARS-CoV-2のみならず将来の変異コロナウイルスに対する経口治療候補化合物を特定
- ✓ 社会的責任への取り組みの一環として当社が主導する国際的な企業間の協力のもと急速に進展



SARS-COV-2のみならず将来の変異コロナウイルスと戦うために、現在、同定した分子の開発を加速できる抗ウイルス開発専門のパートナーを探しています



4

## 戦略的成長プランと 2021年以降のビジョン

# 企業価値拡大を目指す戦略的成長プラン

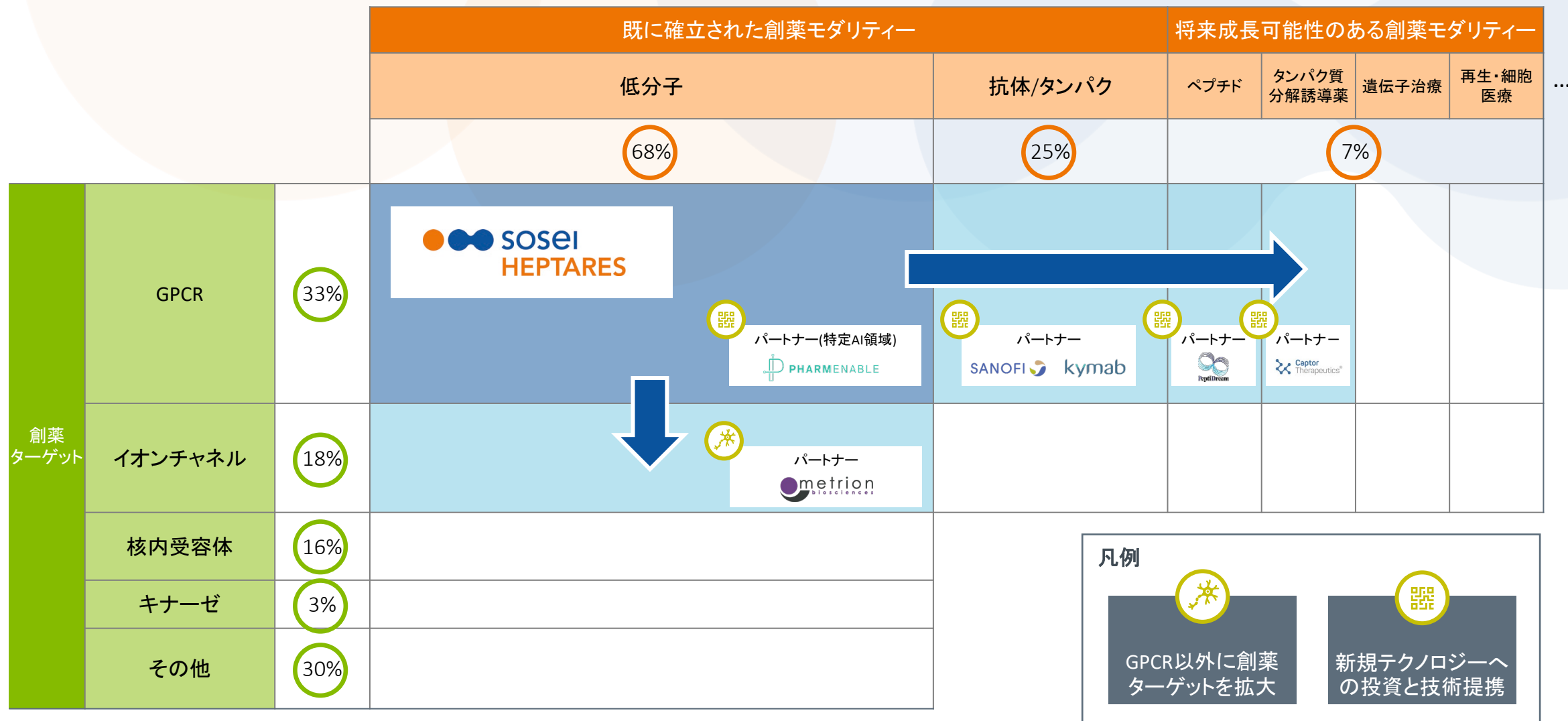


将来の成長を見据えた新たな収益源・テクノロジーの獲得を目指す

-  2020度実施の提携
-  2021年度実施の提携(補足資料参照)



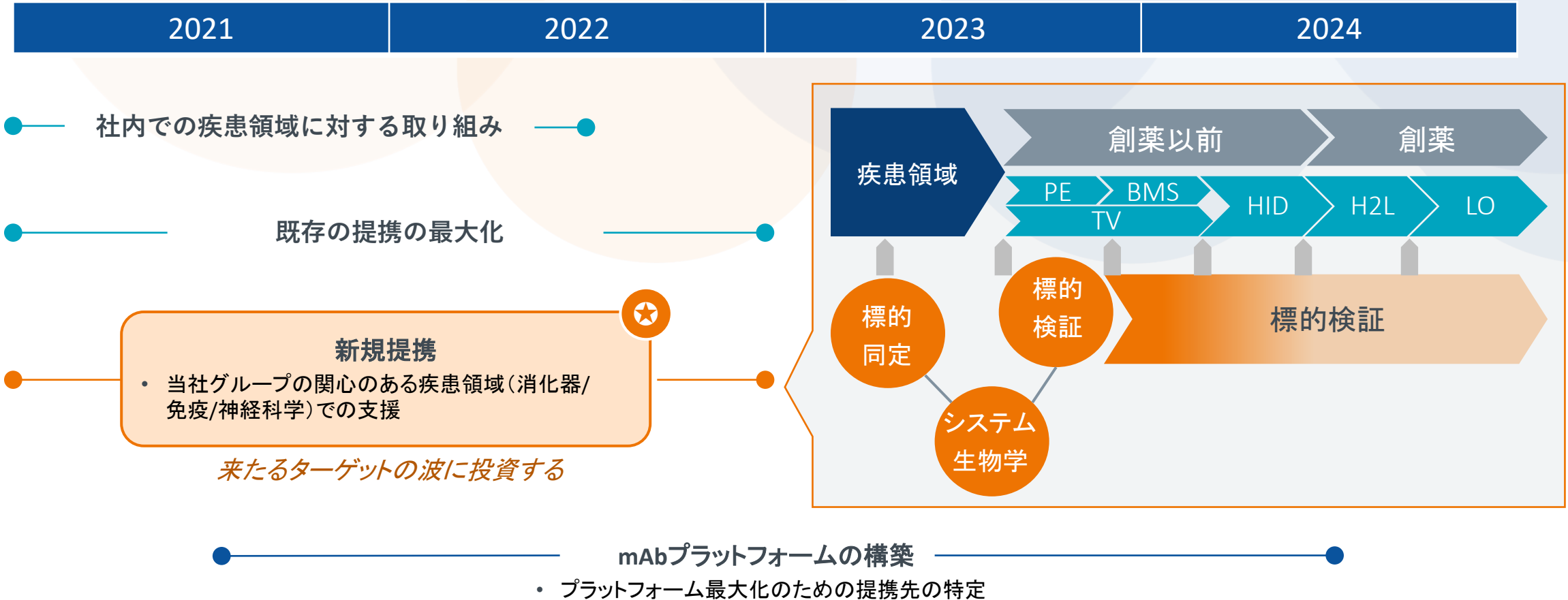
# 戦略的技術提携の拡大を通じ、創薬領域の最大50%をカバー



○ : 主なタンパク質ファミリーをターゲットとする、承認済み低分子薬が対象とするターゲットの割合 (Nature Reviews Drug Discovery volume 16, pages19–34(2017))

○ : 過去5年間(2015-2019)にFDAに承認された新薬のモダリティ別の割合

# 新規TIVフレームワーク – 中期的にファーストインクラスとなりうる創薬ターゲット探索への投資と協業・提携を目指す



2021年以降、外部との技術上の協業・提携を積極的に拡大

注: PE=Protein Engineering (タンパク質工学); BMS=Biomolecular Structure(生体分子構造); TV=Target Validation(ターゲット検証); HID=ヒット化合物同定; H2L=Hit-to-Lead; LO=リード化合物同定

# ESGに関する当社グループの主な指標



## 環境

### 研究所での1人当たりCO2排出量

2020年	4.17トン
2019年	5.07トン

### 創薬産業の効率化

#### 創薬数ランキング\*

6個 54位/2,258社中

#### ライセンス金額ランキング\*\*

1兆円+ 7位/ 世界中の全製薬企業中



## 社会

### ダイバーシティ

女性管理職比率	26%
外国籍従業員比率	78%

### 科学コミュニティへの貢献

掲載論文数	200+
構造解析数	300+

SBDDをCOVID-19の  
グローバルな研究開発に活用



## ガバナンス

### ガバナンス体制

#### 取締役会の社外取締役比率

83%

(日本の全製薬企業中トップ)

#### 取締役会の外国籍取締役比率

33%

\*直近5年の新規臨床シーズの起源会社の分析。明日の新薬、当社開示資料より作成 \*\*Evaluate Pharma  
LINK: <https://www.oseiheptares.com/investors/sustainability.html>

# ESGにおける3つの要諦

1

通り一遍の流れに乗るためではないし、そうあってはならない

2

本質は各人が本心から他人を慈しむ、利他の修行の深化

3

利潤の追求の正当化 (Max Weber) → 論語と算盤 (渋沢栄一)



Max Weber



渋沢栄一

# 2021年度の優先目標



## ESGリーダーを目指す

- 全社で持続可能なESGの活動とポリシーを推進
- ヒトコロナウイルスの経口治療薬候補のさらなる開発のためのコロナウイルスプログラム推進および業界パートナーとのコラボレーションの確立



## 内部成長プランの推進

- テクノロジー / プラットフォームにおけるリーダーシップの拡大
- 高品質な新規医薬品候補の創出
- 創薬および開発パイプラインの充実
- 2~3つの新規提携または共同投資の実現



## 戦略的成長プランの実行

- 収益創出につながる企業買収を模索
- 新規テクノロジーへの投資と技術提携によりGPCR以外の新規ターゲットへ創薬の範囲を拡大
- 後期臨床開発段階のアセットを日本市場向けに導入



5

補足資料

# アラガンによる55百万ドル超の研究資金の投入で 導出時よりも強化されたポートフォリオが当社グループに返還

開発中のすべてのプログラムと、関連するすべての知的財産権、前臨床・臨床データを取得

新たに見出された化学構造を持つ次世代の選択的ムスカリン作動薬パイプラインを含む

StaR/SBDDプラットフォームによりデザインされた特許取得済みのM<sub>4</sub>作動薬、M<sub>1</sub>作動薬、M<sub>1</sub>/M<sub>4</sub>作動薬のバックアップ化合物が前臨床入り

プログラム	化合物	ステージ
M <sub>4</sub> 作動薬	HTL16878	Ph 1
	非開示	前臨床
M <sub>1</sub> 作動薬	HTL18318	Ph 1
	HTL9936	Ph 1
	非開示	前臨床候補選択
	非開示	探索
	非開示	探索
M <sub>1</sub> / M <sub>4</sub> デュアル作動薬	非開示	前臨床候補選択



ムスカリンプログラムの社内レビューを完了  
全プログラムへの投資を継続しながら、M<sub>4</sub>作動薬プログラムへの増加投資を決定

# 患者にとって革新的薬剤となる可能性

ムスカリンM<sub>4</sub>およびM<sub>1</sub>受容体は精神障害・認知障害の治療への有効性が確立した標的

ムスカリンM<sub>4</sub>およびM<sub>1</sub>受容体はそれぞれ精神障害・認知障害の治療に有効な標的

25年以上にわたる大手製薬会社の取り組みにもかかわらず、選択的オルソステリック作動薬\*の創薬は非常に困難

~2000万

統合失調症



全世界の患者数

~5000万

認知症

\$8180億

社会的コスト



認知症のコスト

1.1%

全世界のGDP比

M<sub>4</sub>/M<sub>1</sub>選択的作動薬のキサノメリンは、統合失調症・認知症患者を対象にしたプラセボ対照二重盲検比較試験でPOC (Proof of Concept)を確立

Selective muscarinic receptor agonist xanomeline as a novel treatment approach for schizophrenia

Anantha Shekhar<sup>1</sup>, William Z Potter, Jeffrey Lightfoot, John Lienemann, Sanjay Dubé, Craig Mallinckrodt, Frank P Bymaster, David L McKinzie, Christian C Felder

Effects of xanomeline, a selective muscarinic receptor agonist, on cognitive function and behavioral symptoms in Alzheimer disease

N C Bodick<sup>1</sup>, W W Offen, A I Levey, N R Cutler, S G Gauthier, A Satlin, H E Shannon, G D Tollefson, K Rasmussen, F P Bymaster, D J Hurley, W Z Potter, S M Paul

末梢性ムスカリンM<sub>2</sub>およびM<sub>3</sub>受容体に作用しない  
ムスカリンM<sub>4</sub>および/またはM<sub>1</sub>受容体作動薬は革新的薬剤となる可能性

\*オルソステリック作動薬: 受容体のリガンド結合部位と同じ部位に結合するメカニズムを持つ作動薬  
出典: 世界保健機関



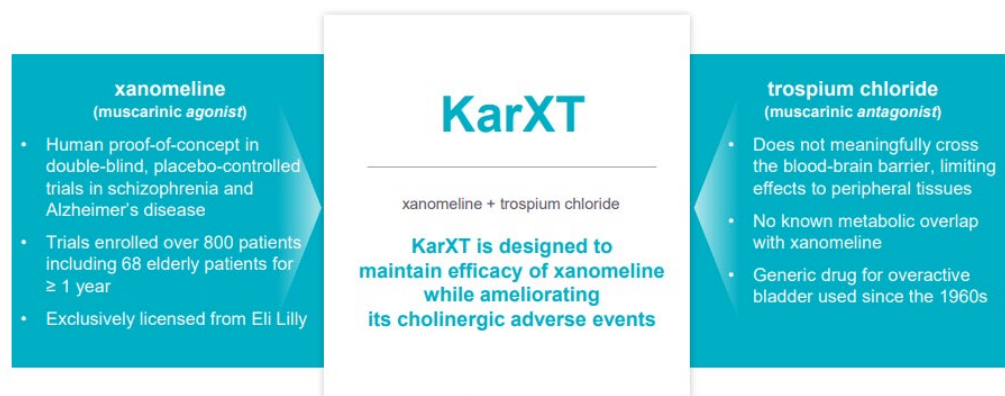
# M<sub>4</sub>作動薬は革新的薬剤となる可能性

ムスカリン作動薬プログラムの可能性がKaruna社とCerevel社の進捗で裏付けられつつある



## KarXT (M<sub>1</sub>/M<sub>4</sub>作動薬、M<sub>2</sub>/M<sub>3</sub>拮抗薬)

### KarXT: Proprietary lead product candidate



Sources: Bodick et al. 1997, Shekhar et al. 2008



RATIONALE FOR KarXT | 10

## CVL-231 (M<sub>4</sub> PAM)

### Cerevel's Selective M<sub>4</sub> Modulation: A Compelling and Differentiated Approach to Drive Antipsychosis

#### M<sub>4</sub> Selectively Impacts Brain Functions

Other Muscarinic Receptors	Potential Effect	M <sub>4</sub> Muscarinic Receptor
-	Antipsychosis	✓✓
✓✓	Cognition	✓
✓✓	GI Side Effects	-
✓	Cardiovascular	✓

#### Receptor Subtype Selectivity Offers Potential Improvement

Xanomeline (M<sub>1</sub>/M<sub>4</sub>) data from Schizophrenia and Alzheimer's patients show targeting muscarinic receptor impacts brain function  
*But development limited by GI and CV side effects*

Karuna's KarXT creatively addresses this by adding trospium to Xanomeline to offset side effects  
*Non-selective approach*

M<sub>4</sub> Knock-out mouse data suggests M<sub>4</sub> receptors drive the antipsychotic activity of Xanomeline

*M<sub>1</sub> receptors believed to contribute to worrisome side effects*

CVL-231:  
Highly Selective Once-daily (QD) M<sub>4</sub> PAM

>800X  
more selective for  
M<sub>4</sub> over M<sub>1</sub>, 3 and 5

>390X  
more selective  
than for M<sub>2</sub>



Source: 1. Shekhar et al. Am J Psychiatry, Vol 165, Aug 2008, N=20. 2 active and 3 placebo-arm patients discontinued the study, none due to adverse events.  
2. Bodick et al. Arch Neurol, Vol 54, Apr 1997, N = 343. 52% of patients in high-dose arm discontinued treatment due to adverse events.

© Cerevel Therapeutics Holdings, Inc

13

Karuna社のKarXT<sup>1</sup>とCerevel社のCVL-231<sup>2</sup>により、投資家と医薬品業界は  
精神障害・認知障害治療におけるムスカリン作動薬プログラムの可能性を再認識

1. KarXTはキサノメリン(ムスカリンM<sub>1</sub>/M<sub>4</sub> 選択的作動薬)と塩化トロスピウム(ムスカリンM<sub>2</sub>/M<sub>3</sub>拮抗薬)の組み合わせ 出典: Karuna Therapeutics会社説明資料(2020年12月) [LINK](#)

2. CVL-231は選択的ムスカリンM<sub>4</sub> ポジティブアロステリックモジュレーター(PAM) 出典: Cerevel Therapeutics会社説明資料(2020年11月) [LINK](#)



# M<sub>4</sub>作動薬は革新的薬剤となる可能性

統合失調症には大きなアンメットメディカルニーズが存在

ブロックバスターが  
生まれうる大きな市場規模

~2000万人

全世界の  
統合失調症患者数

限定的な有効性と重度の副作用  
にもかかわらず、ブロックバスター  
となる売上高の規模

\$100億+  
(2020年)



\$130億+  
(2026年)

ZYPREXA  
Olanzapine

Seroquel<sup>®</sup>  
quetiapine

ABILIFY<sup>®</sup>  
(aripiprazole)  
2, 5, 10, 15, 20 mg tablets

ここ70年間イノベーションはない

現在の治療法も作用機序は  
1950年代と同様

第一世代

D2調整薬

非定型

D2/5HTデュアル  
調整薬

第二世代  
非定型

D2/5HTデュアル  
調整薬

Vraylar<sup>®</sup>  
(cariprazine) capsules

REXULTI<sup>®</sup>  
(brexipiprazole)

CAPLYTA<sup>®</sup>  
(lumateperone) capsules

HTL16878に大きな可能性



選択的M<sub>4</sub>作動薬



新しい作用機序のファースト  
インクラスとなる可能性



より高い容認性

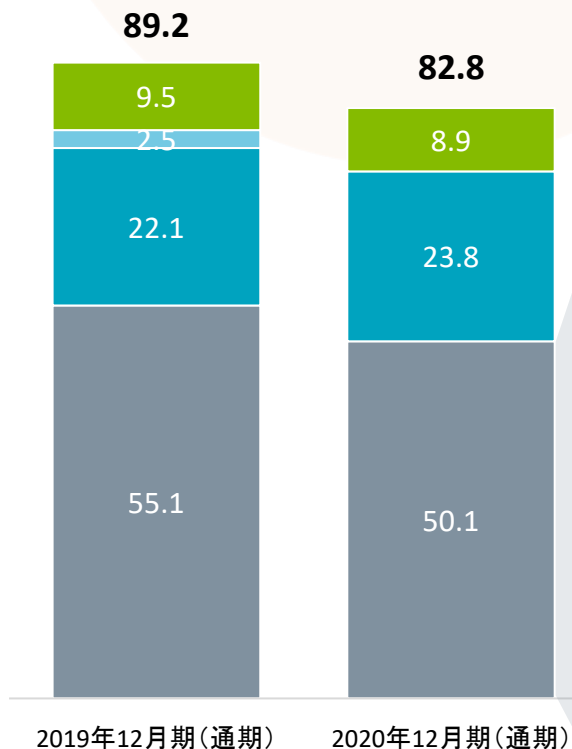


統合失調症の新たな治療の  
選択肢に対する大きなニーズ

現在の非定型抗精神病薬の重い副作用は、高い再発率、増悪、治療の中止を招き、  
新たな治療方法の誕生が強く望まれる

# セグメント別売上高の詳細(IFRS)

百万ドル



- その他
- 医薬品販売
- ロイヤルティ
- マイルストーンおよび契約一時金

通期売上高に計上されたマイルストーンおよび契約一時金の内訳<sup>1</sup>

時期	2019年の関連イベント	売上高 (百万ドル)
19年1月	AZD4635のPhase2試験開始	15.0
19年2月	FFTCからオラビのマイルストーン受領	1.8
19年2月	Inexia社からの契約一時金	0.3
19年2月	Orexia社/Inexia社の株式受領	2.3
19年2月	第一三共の構造解析完了	0.5
19年5月	ファイザー社の臨床開発候補物質獲得(1)	3.0
19年5月	ノバルティス社のEnerzair®がEUで承認申請	2.5
19年5月	ファイザー社の臨床開発候補物質獲得(2)	3.0
19年7月	ジェネンテック社との提携一時金	7.6
19年8月	武田薬品との提携一時金	10.0
19年9月	ジェネンテック社のターゲット選定	0.8
19年12月	ファイザー社のPhase1試験開始(1)	5.0
19年12月	ファイザー社の臨床開発候補物質獲得(3)	3.0
	その他パートナー企業からの収入	0.8

時期	2020年の関連イベント	売上高 (百万ドル)
20年2月	第一三共のリード化合物獲得	1.5
20年6月	アツヴィ社との提携一時金	2.5
20年6月	ノバルティス社のEnerzair®が日本で承認	1.3
20年7月	ノバルティス社のEnerzair®がEUで承認	5.0
20年8月	武田薬品の構造解析完了	0.3
20年9月	ファイザー社のPhase1試験開始(2)	5.0
20年11月	Tempero Bio社からの契約一時金	5.0
20年11月	Tempero Bio社の株式受領	2.0
20年11月	バイオヘイブン社からの契約一時金	5.0
20年11月	バイオヘイブン社の株式受領	4.7
20年12月	AbbVie社の構造解析完了	0.7
20年12月	武田薬品工業の構造解析完了	0.3
20年12月	GSK社の契約一時金	12.5
	その他パートナー企業からの収入	4.3

注: <sup>1</sup> 売上高は該当する決算期の会計上の売上高で、実際に受領した現金とは異なる場合があります

# 提携済パイプラインの進捗

■ 2019年末時点の開発段階  
■ 2020年～現在までの進展

製品名/開発コード	ターゲット/作用機序	モダリティ	適応症	パートナー	基礎	前臨床	Ph1	Ph2	Ph3	申請	販売
<b>伝統的な導出プロジェクト</b>											
シーブリ®	LAMA	低分子	COPD	NOVARTIS	■	■	■	■	■	■	■
ウルティプロ®	LAMA+LABA	低分子	COPD	NOVARTIS	■	■	■	■	■	■	■
エナジア®	LAMA+LABA+ICS	低分子	喘息	NOVARTIS	■	■	■	■	■	■	■
オラビ®	抗真菌薬ミコナゾール	低分子	口腔咽頭カンジダ症	FUJIFILM	■	■	■	■	■	■	■
Imaradenant	アデノシンA2a拮抗薬(併用)	低分子	転移性去勢抵抗性前立腺がん	AstraZeneca	■	■	■	■	■	■	■
Imaradenant	アデノシンA2a拮抗薬	低分子	固形がん	AstraZeneca	■	■	■	■	■	■	■
PF-07081532	GLP-1作動薬	低分子	2型糖尿病/肥満	Pfizer	■	■	■	■	■	■	■
PF-07054894	CCR6拮抗薬	低分子	炎症性腸疾患	Pfizer	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	(非開示)	低分子	代謝性疾患・その他	Pfizer	■	■	■	■	■	■	■
BHV3100	CGRP拮抗薬	低分子	神経疾患	biohaven	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	GPR35作動薬	低分子	炎症性腸疾患	gsk	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	複数ターゲット	低分子	複数の適応症	Pfizer	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	複数ターゲット	低分子/生物製剤	複数の適応症	Genentech	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	複数ターゲット	低分子/生物製剤	消化器疾患・その他	Takeda	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	単一ターゲット	低分子	炎症性疾患	abbvie	■	■	■	■	■	■	■
<b>共同開発プロジェクト(収益分配型)</b>											
KY1051	抗CXCR4抗体	モノクローナル抗体	がん免疫	SANOFI kymab	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	PAR-2	ペプチド	炎症性疾患	teptidream	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	標的タンパク質分解誘導薬	低分子	消化器疾患	Captor Therapeutics	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	AI創薬	低分子	神経疾患	PHARMENABLE	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	イオンチャンネル創薬	低分子	神経疾患	metrion	■	■	■	■	■	■	■
<b>アセット特化型企业(共同投資)</b>											
TMP301	mGlu5 NAM	低分子	物質使用障害/不安障害	Temporo Bio	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	OX1/OX2 作動薬	低分子(経口)	ナルコレプシー	Orexia	■	■	■	■	■	■	■
(非開示)	OX1/OX2 作動薬	低分子(経鼻)	ナルコレプシー	INEXIA	■	■	■	■	■	■	■

注: シーブリ®, ウルティプロ®, エナジア® はノバルティス社の登録商標です

# 自社開発パイプラインの進捗

■ 2019年末時点の開発段階  
■ 2020年～現在までの進展

開発コード	ターゲット/作用機序	モダリティ	適応症	パートナー	基礎	前臨床	Ph1	Ph2	Ph3	申請	販売
<b>自社開発品(提携前)</b>											
HTL0016878	ムスカリンM4作動薬	低分子	神経疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床, Ph1, Ph2]						
HLT0018318	ムスカリンM1作動薬	低分子	神経疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床, Ph1, Ph2]						
HLT009936	ムスカリンM1作動薬	低分子	神経疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床, Ph1, Ph2]						
(非開示)	ムスカリンM1作動薬Backup	低分子	神経疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床]						
(非開示)	ムスカリンM4作動薬Backup	低分子	神経疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床]						
(非開示)	ムスカリンM1/M4作動薬	低分子	神経疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床]						
HTL0030310	SSTR5作動薬	ペプチド	内分泌疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床, Ph1]						
(非開示) <sup>1</sup>	GLP-1拮抗薬	ペプチド	内分泌疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床]						
(非開示)	GLP-2作動薬	ペプチド	腸疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床]						
(非開示)	H4拮抗薬	低分子	アトピー性皮膚炎	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床]						
(非開示)	EP4拮抗薬	低分子	がん免疫	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床]						
(非開示)	GPR52作動薬	低分子	神経疾患	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床]						
(非開示)	抗PAR-2抗体	モノクローナル抗体	アトピー性皮膚炎	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床]						
(非開示)	SARS CoV-2 Mpro阻害薬	低分子	コロナウイルス感染症	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎]						
複数ターゲット	(非開示)	低分子/生物製剤	神経疾患領域	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎]						
複数ターゲット	(非開示)	低分子/生物製剤	消化器・炎症性疾患領域	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎]						
複数ターゲット	(非開示)	低分子/生物製剤	免疫疾患領域	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎]						
<b>自社開発品(中断中)</b>											
HTL0018318 <sup>2</sup>	ムスカリンM1作動薬	低分子	DLB	●●● SOSEI HEPTARES	[Progress bar: 基礎, 前臨床, Ph1, Ph2]						

注: <sup>1</sup> GLP-1拮抗薬のライセンスを取得するオプションは2020年12月31日まで行使されなかったため、プログラムは現在自社開発されています。<sup>2</sup> 日本でのレビー小体型認知症(DLB)を対象としたHTL0018318の第II相臨床試験は中止しました。当社グループは、医薬品医療機器総合機構(PMDA)へHTL0018318(あるいは別の新規M1作動薬候補)の新たな治験届を将来再提出する予定です



## SOSEI HEPTARES

〒102-0083

東京都千代田区麹町2-1

PMO半蔵門11F

The Steinmetz Building

Granta Park, Cambridge

CB21 6DG

United Kingdom

North West House

119 Marylebone Road

London NW1 5PU

United Kingdom