

当資料は、ガラパゴス NV が、2022 年 2 月 2 日（現地時間）に発表したプレスリリース (<https://www.glpq.com/press-releases>) を邦訳し、参考資料として提供するものです。正式な言語は英語であり、その内容および解釈については英語が優先いたします。なお本文中には日本での未承認薬、未承認適応症に関する情報が含まれています。国内におけるジセレカ®の効能または効果および用法・用量については、添付文書をご参照ください。

ガラパゴス、潰瘍性大腸炎（UC）の治療に関するさらなる情報を 欧州クローン病・大腸炎会議（ECCO）年次総会で提供

－ガラパゴスの炎症領域および UC へのコミットメントを示す

9つのプレゼンテーションを発表予定－

－ジセレカ®（フィルゴチニブ）の第 III 相 SELECTION 試験と SELECTION 長期投与試験から得た 4 つの新たな解析結果より、UC の管理に関する新たな情報を提供－

－残存病変の症状や生活の質を含む疾病負荷を調査した

欧州のリアルワールドデータの初期結果－

ギリアド・サイエンシズ株式会社（本社：東京都千代田区、以下「ギリアド」）は、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：GLPG、以下「ガラパゴス」）が 2022 年 2 月 16 日から 19 日に開催される欧州クローン病・大腸炎会議（ECCO）の年次総会において、データを提供することを発表します。本会議では、第 III 相 SELECTION 試験および SELECTION 長期投与（LTE）試験の 4 つの新たな解析結果を含む 9 つの口演およびポスタープレゼンテーションを行う予定です。これらは、既存治療または生物学的製剤のいずれかで効果不十分、効果がなくなった、あるいは不耐容であった中等症から重症の UC 患者さんを対象に、1 日 1 回経口投与の JAK1 阻害剤であるジセレカ（フィルゴチニブ）の有効性および安全性を評価する臨床プログラムの一部です。また、欧州で実施された UC の疾患負荷に関する調査に参加した患者さんからの情報も発表予定です。

ガラパゴスのチーフ・メディカル・オフィサーのワリド・アビサーブ博士（Dr. Walid Abi-Saab）は、次のように述べています。「ガラパゴスは、UC の管理において包括的なアプローチが非常に重要であり、それによりこの疾患と闘う人々の生活に大きな違いをもたらすことができると信じています。当社は UC の患者さんにとって何が最も重要かを理解

し、この消耗性疾患をより良く治療する方法を見つけることにコミットしています。その結果は、ECCO で発表する幅広い新たなデータに反映されています」

今回の新たな解析結果は、UC 治療においてフィルゴチニブ 200mg が適切な患者さんに使用された場合の有効性および安全性プロファイルのエビデンスを示しています。

- UC の転帰を改善するための治療ゴールを設定する上で、疾患の包括的な評価と主観的指標は客観的指標と同様に重要であると考えられます。今回の SELECTION 試験の事後解析では、プラセボと比較して、フィルゴチニブ（100mg および 200mg）を投与された患者さんの臨床的、生物学的、健康関連 QOL（HRQoL）の寛解および内視鏡的改善を含む複合エンドポイントを評価しました。
- SELECTION 試験では UC 患者さんにおけるフィルゴチニブ 200mg の忍容性は良好であり、プラセボと比較して、臨床的寛解の導入と維持が認められました¹。SELECTION LTE 試験の中間解析では、96 週までの長期投与におけるフィルゴチニブ 200mg の有効性および安全性を評価しています。
- UC の長期治療は、さまざまな理由で治療を中断しなければならない患者さんにとって困難を伴います²。SELECTION 試験および SELECTION LTE 試験の事後解析では、治療中断後にフィルゴチニブを再投与した場合の有効性と安全性を評価しました。
- 炎症性腸疾患（IBD）の有病率が上昇している高齢患者さんにおける治療の影響を理解することが临床上必要とされています³。今回の SELECTION 試験の事後解析では、年齢で層別化したフィルゴチニブの有効性と安全性を評価しています。

ガラパゴスは、臨床データに加えて、寛解期あるいは活動期における中等症から重症の UC 患者さんの残存病変や QOL の低下などの疾患負荷に関する欧州のリアルワールドデータの初期結果を発表予定です。

口演およびポスタープレゼンテーション

演題名	発表者	発表日時
フィルゴチニブを投与された UC 患者さんにおける臨床的・生物学的、HRQoL の寛解と内視鏡的改善と疾患コントロールを探る：SELECTION 試験の事後解析より	<u>Stefan Schreiber</u> , Brian Feagan, Laurent Peyrin-Biroulet, Severine Vermeire, Margaux Faes, Kristina Harris, Alessandra Oortwijn, Patrick Daniele, Haridarshan Patel, Silvio Danese	口演：OP07 日時：2022 年 2 月 17 日 セッション：IBD の大海原を航海する。サイエンティフィックセッション 3：IBD における高い治療目標を設定する：現代のイカルス？ 時間：16:00 - 17:20 CET プレゼンテーション時間：16:40 - 16:50 CET
IBD 患者さんに対する年齢層別化フィルゴチニブの有効性と安全性：第 IIb/III 相の SELECTION 試験および SELECTION LTE 試験の事後解析より	<u>Stefan Schreiber</u> , <u>Edward V Loftus Jr</u> , Christian Maaser, Silvio Danese, Christine Rudolph, Rob Jongen, Angela De Haas, Alessandra Oortwijn and Séverine Vermeire	オンライン口演:DOP37 日時：2022 年 2 月 17 日 セッション：DOP セッション 5：サザン：IBD の低分子化合物 時間：17:30-18:30 CET プレゼンテーション時間：17:30-17:36 CET
UC 患者さんの治療中断後のフィルゴチニブによる再治療について：SELECTION 試験および SELECTION LTE 試験の解析結果より	<u>Séverine Vermeire</u> , Brian Feagan, Laurent Peyrin-Biroulet, Alessandra Oortwijn, Margaux Faes, Angela de Haas and Gerhard Rogler	ポスター：P517 日時：2022 年 2 月 18 日 セッション：ガイド付ポスターセッション ポスターディスカッション時間：12:30-13:30 CET
UC 患者さんにおけるフィルゴチニブ 200mg 長期投与の有効性と安全性の結果：SELECTION LTE 試験の中間解析より	<u>Brian Feagan</u> , Katsuyoshi Matsuoka, Gerhard Rogler, Margaux Faes, Alessandra Oortwijn, Angela de Haas, Christine Rudolph, Haridarshan Patel and Laurent Peyrin-Biroulet	ポスター：P491 日時：2022 年 2 月 18 日 セッション：ガイド付ポスターセッション ディスカッション・セッション：12:30-13:30 CET

ドイツの実臨床での UC 患者さんの臨床的寛解率	<u>Bernd Bokemeyer</u> , Nils Picker, Daniel Kromer, Ludger Rosin and Haridarshan Patel	ポスター：P506 日時：2022 年 2 月 18 日 セッション：ガイド付ポスターセッション ポスターディスカッション時間：12:30-13:30 CET
ドイツの実臨床において先進治療を受けた UC 患者さんの効果不十分を示す指標について	<u>Bernd Bokemeyer</u> , Nils Picker, Daniel Kromer, Ludger Rosin and Haridarshan Patel	ポスター：P598 日時：2022 年 2 月 18 日 セッション：ガイド付ポスターセッション ポスターディスカッション時間：12:30-13:30 CET
UC 患者さんにおける先進治療で効果不十分を示す指標について：英国におけるカルテレビューの結果より	<u>James Oliver Lindsay</u> , Nils Picker, Daniel Kromer, Michael Smyth and Haridarshan Patel	ポスター：P389 日時：2022 年 2 月 18 日 セッション：ガイド付ポスターセッション ポスターディスカッション時間：12:30-13:30 CET
UC 患者さんの疾患負担に関する洞察：欧州のリアルワールド調査から得られた知見より	<u>Johan Michael Burisch</u> , Ailsa Hart, Alessandra Oortwijn, Javaria Mona Khalid, Fritha Hennessy, Hannah Knight, Rachael Meadows, Haridarshan Patel and Alessandro Armuzzi	ポスター：P293 日時：2022 年 2 月 18 日 セッション：ガイド付ポスターセッション ポスターディスカッション時間：12:30-13:30 CET

UC について

UC は免疫系の異常反応により発症する炎症性腸疾患（IBD）です。欧州では、UC とクローン病（CD）を含む約 250 万人から 300 万人⁴が IBD に罹患していると推定されています。UC は消化管の慢性炎症性疾患であり、病状の経過は、多くの場合、症状が重くなる活動期とそれに続く寛解期を繰り返します。症状の悪化による身体的な影響に加え、精神的な影響も大きく、症状が中等症から重症の患者さんについては、QOL が著しく低下し、予後も悪い場合が多くみられます。

第 III 相 SELECTION 試験について

第 III 相 SELECTION 試験は、中等症から重症の活動性 UC の成人患者さんを対象とした、選択的 JAK1 阻害剤であるフィルゴチニブの安全性と有効性を評価する多施設共同、無作為化、二重盲検、プラセボ対照試験です。本試験は、寛解導入試験 2 試験と寛解維持試験 1

試験で構成されています。寛解導入試験 A では、生物学的製剤の使用歴のない患者さん、寛解導入試験 B では生物学的製剤の使用歴のある患者さんが含まれています。

SELECTION 試験の主目的は、寛解導入試験では 10 週時、寛解維持試験では 58 週時に、プラセボと比較したフィルゴチニブの有効性を、臨床的寛解の達成（Mayo 内視鏡サブスコア 0 または 1、直腸出血サブスコア 0 および排便回数サブスコアがベースラインから 1 ポイント減少して 0 または 1 を達成した場合）を指標として評価することです。SELECTION 試験に登録された適格な患者さんは、フィルゴチニブの長期安全性を評価するために、進行中の SELECTION LTE 試験に移行しました。SELECTION 試験の適格基準を満たした多くの患者さん（n=1,348）は、ベースライン時の Mayo Clinic Score（MCS）が 9 点以上であり、生物学的製剤の使用歴のある患者さん（n=297/689）の 43% が TNF 拮抗薬およびベドリスマブに対して効果不十分でした。

フィルゴチニブについて

フィルゴチニブは、1 種類以上の疾患修飾性抗リウマチ薬（DMARDs）で効果不十分または不耐容の中等症から重症の関節リウマチ（RA）成人患者さんの治療薬として、欧州連合、英国および日本において、ジセレカ（200 mg および 100 mg 錠）として承認および販売されています。フィルゴチニブは、単剤療法またはメトトレキサート（MTX）との併用療法として使用されます。また、フィルゴチニブは欧州連合および英国において、既存治療または生物学的製剤のいずれかで効果不十分、効果がなくなった、あるいは不耐容であった中等症から重症の活動期 UC の成人患者さんの治療薬として承認および販売されています。日本では、中等症から重症の活動性 UC の成人患者さんの治療薬として独立行政法人医薬品医療機器総合機構（PMDA）に申請し、審査を受けています。

欧州におけるフィルゴチニブの製品概要には、禁忌、特別な警告及び使用上の注意が記載されており、www.ema.europa.eu で閲覧可能です。英国におけるフィルゴチニブの製品概要は、www.medicines.org.uk/emc、北アイルランドにおけるフィルゴチニブの製品概要は www.emcmedicines.com/en-GB/northernireland で閲覧可能です。厚生労働省のインタビューフォームは www.info.pmda.go.jp に掲載されています。

クローン病を対象としたフィルゴチニブの国際共同第 III 相試験が進行中です。臨床試験の詳細については、<https://www.clinicaltrials.gov> を参照してください。

ジセレカ®は、ガラパゴス NV およびギリアド・サイエンシズ、またはその関連会社の商標です。

フィルゴチニブの提携について

ギリアドとガラパゴスは、フィルゴチニブのグローバルな開発および製品化における共同パートナーです。ガラパゴスは欧州におけるフィルゴチニブの製品化を担い、ギリアドは

引き続き、フィルゴチニブの欧州外での販売を担います。日本においてフィルゴチニブは、エーザイ株式会社との共同販売となります。

ガラパゴスについて

ガラパゴス NV 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、開発、製品化を行っています。パイプラインは、炎症性疾患、線維症などの適応症を対象とした創薬から第 III 相試験までのプログラムで構成されています。同社の目標は、革新的な医薬品の創薬、開発、製品化に重点を置いたグローバルなバイオ医薬品企業になることです。

詳細は www.glpq.com にてご覧ください。

¹ Feagan BF et al. *Lancet* (2021) ;397:2372–84.

² Rubin DT. *Gastroenterol Hepatol* (2019) ;15 :612-5

³ Zammarchi et al. *BMG Gastroneterol* (2020) ; 20 :147

⁴ Burisch J. et al. *Journal of Crohn's and Colitis* (2013) ; 7:322-337

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、改正された 1995 年米国私募証券訴訟改革法（Private Securities Litigation Reform Act of 1995）に規定される将来の見通しに関する記述が含まれており、実際の結果が将来予測に関する記述で言及されているものと大きく異なる可能性があるため、これらの記述に対して過度に依拠しないようご注意ください。これらの不確定要素およびその他の要因には、フィルゴチニブの臨床プログラムおよび第 III 相 SELECTION 試験を含む臨床試験および製品開発活動に伴う固有のリスク、競合他社の開発動向、規制当局の承認要件およびフィルゴチニブの進行中および計画中の臨床研究プログラムのデータが、安全性または有効性に関する懸念やその他の理由により、さらなる開発を支持できない可能性、規制当局による他の適応症に対するフィルゴチニブの販売承認の時期や可能性、当該規制当局による追加試験の要求が含まれ、これに限定されるものではありません。また、これらのリスクには、ガラパゴスが現在予定している事業計画を継続できないリスクや事業計画を修正する必要性、ガラパゴスがギリアドとのフィルゴチニブに関する共同研究を含む第三者との共同研究に依存しているリスク、フィルゴチニブの商業化に対するガラパゴスの予測、欧州での展開に対する予測が間違っている可能性、および COVID-19 パンデミックが当社の戦略、事業計画および注力事項に与える影響に関する不確定要素、ならびに 2021 年 12 月 31 日を期末とする Form 20-F およびその後の SEC への提出書類に記載されているリスクおよび不確定要素が含まれ、これらには限定されません。歴史的事実の記述を除くすべての記述は、将来の見通しに関する記述とみなされる可能性があります。ここに含まれる将来の見通しに関する記述は、経営陣の現在の期待と信念に基づくものであり、ここに記載された公表日現在における予想です。ガラパゴスは、新しい情報やその後の出来事、状況や予測のいかなる変化に対しても、将来の見通しに関する記述を更新、または修正する義務を負いません。