

2026年6月15日

各 位

会 社 名 カルナバイオサイエンス株式会社  
代表者名 代表取締役社長 吉野 公一郎  
(コード番号：4572)  
問合せ先 取締役経営管理本部長 山本 詠美  
(TEL：078-302-7075)

docirbrutinibのフェーズ1b試験における良好な抗腫瘍効果と安全性プロファイルを示す  
最新データをEHA2026で発表

- EHA 2026において、現在実施中のフェーズ1b試験で得られたdocirbrutinibの最新データをポスター発表しました
- 複数の前治療歴を有する成熟B細胞腫瘍患者において、良好な安全性プロファイルおよび有効性が確認されました
- 慢性リンパ性白血病 (CLL) 患者において奏効が認められ、暫定的な第2相試験推奨用量である 400 mg BID (1日2回投与) 投与群では、全奏効率 (ORR) 73%を達成しました
- 最新のフェーズ1b試験結果は、docirbrutinibを次の治験段階へと進める臨床開発の継続を支持するものです

2026年6月13日、欧州血液学会 (European Hematology Association 2026 Congress) において、当社が臨床試験を実施中の次世代型BTK阻害剤docirbrutinibのフェーズ1b臨床試験に関する最新の安全性および有効性データが発表されました。

docirbrutinibは当社が創製したブルトン型チロシンキナーゼ (Bruton's tyrosine kinase, BTK) を標的とする高選択的な非共有結合型BTK阻害剤です。現在、共有結合型BTK阻害剤を含む少なくとも2ライン以上の全身療法に不応または不耐となった慢性リンパ性白血病 (CLL)・小リンパ球性リンパ腫 (SLL) ならびにB細胞性非ホジキンリンパ腫 (B-cell NHL) の患者を対象としたフェーズ1b試験を、米国において実施しています。

本ポスターは、テキサス大学MDアンダーソンがんセンター白血病科教授Nitin Jain医師が発表を行いました。

以下のその概要をお知らせいたします。

### 発表の概要

ポスタータイトル：Updated Results from a Phase 1b Study of Non-covalent Pan-mutant BTK Inhibitor Docirbrutinib (AS-1763) in Patients with Previously Treated B-cell Malignancies

(和訳：前治療歴を有する成熟B細胞腫瘍患者を対象とした非共有結合・汎変異型BTK阻害剤 docirbrutinib (AS-1763)のフェーズ1b試験における最新結果)

- docirbrutinibは高選択的な非共有結合・汎変異型BTK阻害剤であり、野生型BTKおよびC481x, T474x, L528xなどの既存の共有結合型・非共有結合型BTK阻害剤に対する耐性変異体を、IC50値 10 nM未満で阻害します。また、不活性化変異体BTK L528Wを有するB細胞性リンパ腫細胞株に対しても強い抗腫瘍活性を示します。
- 本ポスターでは、現在実施中のdocirbrutinibのフェーズ1b試験における、CLL（慢性リンパ性白血病）/SLL（小リンパ球性リンパ腫）、MCL（マントル細胞リンパ腫）、WM（ワルデンシュトレームマクログロブリン血症）、MZL（辺縁帯リンパ腫）、FL（濾胞性リンパ腫）患者についての最新の臨床データが報告されました。
- データカットオフ時点（2026年5月8日）において、58名の患者が5用量群にエントリーされ、その内訳はCLL 33名、MCL 9名、WM 4名、MZL 6名、FL 6名でした。
- 治験薬に関連した心房細動や高血圧の報告はありませんでした。また、グレード3以上の有害事象（治験薬と因果関係あり）の発生割合は10%、治験中止率は2%と、docirbrutinibの高い安全性が示されました。
- 前治療歴のあるCLL/SLL患者に対する有望かつ持続的な奏効が認められており、暫定的な第2相試験推奨用量である400 mg BID投与群では、全奏効率73%を達成し、優れた抗腫瘍効果が確認されました。特に、共有結合型BTK阻害剤およびBCL-2阻害剤の両方の治療歴がある患者においても高い全奏効率（86%）が維持されました。また、変異型BTKを有する患者4名中、3名が部分奏功（PR）となり、全奏効率75%を達成しました。このうち1名はBTK C481Sおよび L528W変異の両方を有しており、1名はC481Sおよびphospholipase C gamma 2 (PLCG2)変異を有していました。
- MCLおよびWMでも良好な治療効果が観察されました。MCL患者の全奏効率は100%であり、これには完全寛解(CR)の症例も含まれます。WM患者では全奏効率および主要奏効率100%となりました。

以上

#### BTK阻害剤docirbrutinib (AS-1763)について

docirbrutinibは、慢性リンパ性白血病（CLL）を含む成熟B細胞腫瘍（血液がんの一種）の治療を目的として開発中の、野生型および薬剤耐性変異型BTKの両方を阻害する高選択的で非共有結合型の経口投与可能な化合物です。イブルチニブを代表とする共有結合型BTK阻害薬は、CLLや他の成熟B細胞腫瘍の標準選択薬として使用されています。しかしながら、多くの患者で、BTKの481番目のシステイン残基（C481）がセリンに置き換わる変異が生じて、共有結合型BTK阻害剤の結合が弱まり、薬剤耐性になることが報告されています。また、ピルトブルチニブを含む開発中の非共有結合型BTK阻害剤に対する新たな耐性変異も報告されています。docirbrutinibは、野生型BTKおよび薬剤耐性変異型BTKのリンパ腫細胞の両方の増殖を強く阻害することから、野生型のみならず薬剤耐性変異型BTKをもつ患者の治療にも有効と考えられ、次世代型BTK阻害剤として開発を進めています。

現在、米国においてフェーズ1b試験を実施しており、2024年10月から用量拡大パートの投与を開始しています。(NCT05602363)