



PRESS RELEASE

PRISM BioLab とエーザイが共同創出した E7386、 エーザイがマイクロトレーサー試験によるヒト薬物動態解析に関する論文を発表

2026年7月2日：一株式会社PRISM BioLab（本社：神奈川県藤沢市、以下「PRISM BioLab」）は、このたび、当社とエーザイ株式会社（本社：東京都文京区、以下「エーザイ」）により共同創出されたE7386

（*1）について、臨床薬理分野の査読付き学術雑誌である「*The Journal of Clinical Pharmacology*」に掲載され、公開されましたのでお知らせいたします。

本試験では、健常成人を対象に、経口 [^{14}C] 放射標識体投与と静脈内 [^{14}C] マイクロトレーサー投与を組み合わせた試験デザインを採用し、E7386の絶対バイオアベイラビリティならびに吸収・代謝・排泄（AME）特性を詳細に評価しました。

詳細につきましては下記をご参照ください。

本試験により、E7386の薬物動態および体内動態特性が定量的に把握され、進行中の臨床開発における知見が得られました。

【論文情報】

雑誌名：*The Journal of Clinical Pharmacology* 2026; **66**(5): e70202

論文タイトル：A Phase 1 Oral Mass Balance and Combined Intravenous [^{14}C] Microtracer Study to Characterize the Absorption, Metabolism, Excretion, and Pharmacokinetics of Antitumor Drug E7386 in Humans

（邦訳：ヒトにおける抗腫瘍薬E7386の吸収、代謝、排泄および薬物動態を評価するための、第 I 相経口マスバランス試験および静脈内 [^{14}C] マイクロトレーサー併用試験）

DOI: <https://doi.org/10.1002/jcph.70202>

【要約】

本試験は、抗腫瘍薬E7386の絶対バイオアベイラビリティ（*5）ならびに吸収・代謝・排泄（AME）特性を評価することを目的として、健常成人を対象に実施された第 I 相臨床薬理試験である。本試験では、経口 [^{14}C] 放射標識体投与と静脈内 [^{14}C] マイクロトレーサー投与を組み合わせた試験デザインを用いることで、薬物動態特性の詳細な評価を行った。

本試験の結果、E7386の絶対バイオアベイラビリティの幾何平均（CV%）は23.6%（34.6）であり、吸収、初回通過効果、および全身性の代謝の影響を受ける体内動態特性が確認された。また、投与放射能の87.9%が回収され、その大部分(85.1%)が糞中に排泄された。

さらに、血中では未変化体が主要な薬物関連成分として確認され、主要代謝物は認められなかった。

これらの結果から、E7386の吸収・代謝・排泄の体内動態特性が定量的に明らかとなった。全体として、E7386の単回静脈内投与および単回経口投与は健常成人において忍容性が認められ、有害事象は管理可能であった。安全性については、単回経口投与および静脈内投与ともに忍容性は良好であり、有害事象は管理可能な範囲であった。

現在、E7386は単剤療法（NCT03264664、NCT03833700）他の抗ガン剤との併用療法（NCT04008797）として臨床評価が進行中である。

<解説>

(*1)E7386について

エーザイと共同創出した経口投与可能なCBP/ β -カテニン相互作用阻害剤であるE7386は、がん細胞の悪性化に関与するCBP/ β -カテニンシグナルの下流において、 β -カテニンとCBPのタンパク相互作用を阻害する経口低分子薬です。2021年10月にPOC(Proof of Concept)を達成し、現在は単剤での固形がんを対象とした第Ⅰ相臨床試験のほか、他の抗がん剤との併用による固形がんを対象とした後期第Ⅰb相／第Ⅱ相臨床試験が、エーザイにより実施されています。

(*2)マイクロトレーサーについて

マイクロトレーサーとは、放射標識した超微量（マイクロドーズ）の薬剤を投与し、体内における吸収・代謝・排泄（AME）および薬物動態を高感度に定量解析する手法です。薬理作用を示さないレベルの微量で実施されるため、安全性への影響は極めて小さいとされています。臨床薬理分野において、バイオアベイラビリティや体内動態の精密評価に広く用いられています。

(*3)バイオアベイラビリティについて

バイオアベイラビリティとは、投与した薬剤のうち全身の血液循環に到達する割合を示す指標であり、絶対バイオアベイラビリティは静脈内投与を基準として経口投与された薬剤の到達割合を評価するものです。経口投与では吸収や腸・肝臓での代謝（初回通過）の影響を受けるため、薬剤の体内での利用可能性を評価する重要な指標とされています。

【株式会社 PRISM BioLab について】

PRISM BioLabは、独自に開発した α -ヘリックス・ β -ターン模倣技術を活用して、低分子化合物によるタンパク質間相互作用（PPI）の制御による創薬を目指している企業です。PRISM BioLabは、従来困難であった細胞内で様々な信号を伝達するPPIを制御する独自のペプチド模倣技術である『PepMetics[®]』を構築し、がんや線維症分野の臨床パイプラインを創出するとともに、国内外の多数の大手製薬会社と提携してこれまでに無い難病治療薬の創出に取り組んでいます。

詳しくは、<https://prismbiolab.com/ja/> をご覧ください。

【PRISM Biolab 会社概要】

社名	： 株式会社PRISM BioLab（PRISM BioLab Co., Ltd.）
創業	： 2006年11月
本社所在地	： 神奈川県藤沢市村岡東二丁目26番地の1 湘南アイパーク
事業内容	： 創薬技術開発及び創薬
代表取締役	： 竹原 大
URL	： https://prismbiolab.com/ja/