

令和7年度「創薬ベンチャーエコシステム強化事業／創薬ベンチャー公募」中間評価（4）報告書

1. 中間評価を実施した課題

課題名	下行性疼痛抑制経路を活性化する経口鎮痛薬 ENDOPIN の開発
研究開発機関	合同会社 B T B 創薬研究センター
リード認定 VC	京都大学イノベーションキャピタル株式会社

2. 本課題の概要

ENDOPIN は、京都大学オリジナル化合物ライブラリーから発見された全く新しい作用機序の経口鎮痛薬候補化合物です。アドレナリン受容体 $\alpha 2B$ 選択的阻害剤である ENDOPIN は、 $\alpha 2B$ 阻害によるネガティブフィードバックによって脳脊髄液中へのノルアドレナリン分泌を亢進させ、下行性疼痛抑制経路を人為的に活性化することで鎮痛作用を示します。モルヒネに匹敵する強力な鎮痛作用を示す一方で、薬効用量の 100 倍以上投与しても、モルヒネなどオピオイド鎮痛薬投与時に見られるような中枢神経系への影響や呼吸抑制・消化器症状等は認められていません。それゆえ、ENDOPIN は、オピオイド鎮痛薬に代わって術後疼痛やがん性疼痛に対する第一選択薬となり、オピオイド鎮痛薬乱用によって欧米で深刻化する、オピオイドクライシスを解決する画期的な疼痛抑制薬となる可能性があります。本補助事業では、米国市場への展開を視野に入れ、米国において第 II 相臨床試験を実施し、臨床 POC 取得を目指します。

3. 評価結果

ステージゲート不通過

【評価コメント】 ステージ 1 で当初計画された項目は実施されており、2025 年 3 月時点でステージゲート通過の評価でした。しかしながら、①2025 年 4 月に認定 VC からの出資意向確認書通りのタイミングで入金がなかったこと、および、②併行して CiCLE 事業において実施した ENDOPIN 単回投与の術後疼痛患者を対象とした第 II 相試験の有効性指標において、データのばらつきが大きく、また、症例数不足で ENDOPIN 群とプラセボ群とで統計的有意性が得られなかったことから、ステージ 2 での反復投与の治験計画については認められず、ステージゲート不通過と評価されました。海外 P1 反復投与試験後、P2 臨床試験デザインで再応募されることを期待します。

以上