1 緒言

Repotrectinib（BMS-986472、TPX−0005）は、ATP 競合性の ROS1、TRK A/B/C 及び ALK を選択的に阻害する経口の低分子 TKI である。Repotrectinib は、コンパクトでかつ強固な構造を有しているため、ゲートキーパー変異や SFM 等の耐性変異による立体障害の影響を受けることなく ATP 結合ポケット内で ATP 結合部位に強固に結合し、臨床的耐性変異も阻害すると考えられる。本作用機序に基づき、ROS1 又は NTRK1〜3 の遺伝子再構成を有する進行固形癌に対し、Repotrectinib の開発が進められている。

今般、ROS1、NTRK1〜3 又は ALK 融合遺伝子陽性の進行固形癌患者を対象とした国際共同第 1/2 相試験（TPX-0005-01 試験、TRIDENT-1 試験）において、ROS1 融合遺伝子陽性の切除不能な進行・再発の NSCLC における Repotrectinib の良好な有効性及び許容可能な安全性が示されたことから、本製造販売承認申請を行うこととした。