

## 副作用リスクの低減が期待される次世代オピオイド系鎮痛薬候補化合物「KSB-200」を創出



2026年7月6日  
東レ株式会社

東レ株式会社（本社：東京都中央区、代表取締役社長：大矢 光雄、以下「東レ」）は、このたび、術後疼痛などを対象とした探索的な非臨床評価において、鎮痛作用が示唆されるとともに、鎮痛作用と鎮静作用との分離の改善が示唆された候補化合物「KSB-200」を創出しました。KSB-200はオピオイドκ（カッパ）受容体（以下「κ受容体」）に対して作動活性を有する化合物であり、副作用リスクが低く、経口投与が可能な新たな鎮痛薬としての開発が期待されます。

これまで、術後疼痛の治療には、強い痛みに対して高い鎮痛効果を有する薬剤として、主にオピオイドμ（ミュー）受容体（以下「μ受容体」）を介して作用する鎮痛薬が使用されてきました。一方、μ受容体作動薬は、呼吸抑制や依存性などの重篤な副作用を伴う場合があり、より安全性の高い鎮痛薬の創出が求められています。

また、既存のκ受容体作動薬は、呼吸抑制や依存性のリスクが低い半面、鎮痛薬として開発をするためには、鎮静や嫌悪感などの中枢性副作用を低減する必要がありました。東レは、透析患者、慢性肝疾患患者における難治性掻痒症治療薬として承認を取得した、κ受容体に対して作動活性を有する化合物TRK-820（一般名：ナルフラフィン塩酸塩、商品名：レミッチ®<sup>※1</sup>）の研究開発の経験と独自の知見を活用し、中枢性副作用の低減と有効性（鎮痛）の両立が期待される新規κ受容体作動薬の創出を進めてきました。

KSB-200は、κ受容体のシグナル伝達におけるバイアス性<sup>※2</sup>に着目した分子設計により、κ受容体作動薬が有する鎮痛作用を選択的に引き出しつつ、中枢性副作用を可能な限り抑制することを目指した新規化合物です。マウス術後疼痛モデルにおいて、KSB-200は経口投与による鎮痛作用が確認され、既存のκ受容体に対して作動活性を有する化合物であるTRK-820と比較して、鎮痛作用と鎮静作用との分離の改善が示唆されました。

東レは、本研究成果を、International Narcotics Research Conference 2026（開催地：米国コロラド州デンバー、期間：2026年7月13日～7月16日）にて発表予定です。今後は、同学会での発表を皮切りに、早期パートナーシップ戦略<sup>※3</sup>のもと、開発を担当するパートナーの探索を進めていきます。当社はパートナーとの連携を通じてKSB-200の実用化を目指し、医療の発展に貢献してまいります。

### <ご参考>

当ウェブサイトでは、お客様のニーズに合ったより良いサービスを提供するために、クッキーを使用しています。[クッキーポリシー](#)

設定

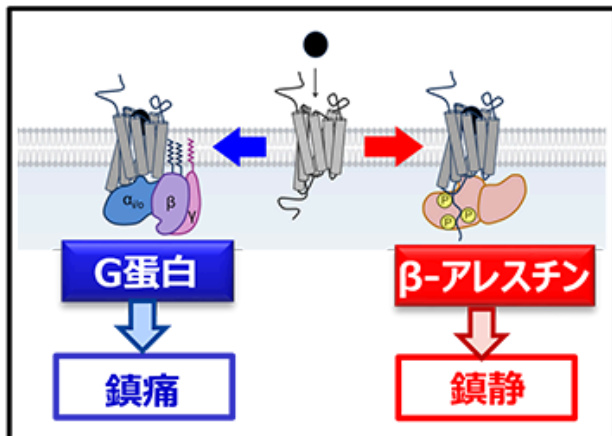
OK

## ※2 バイアス性

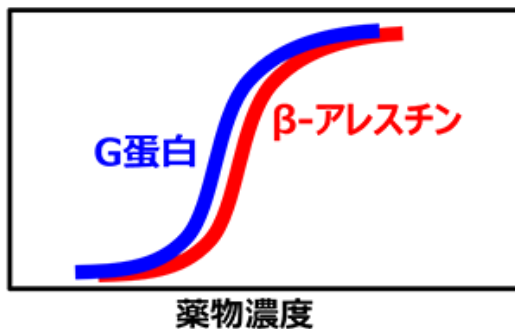
$\kappa$ 受容体が活性化されると、細胞内では主に、Gタンパク質経路、 $\beta$ -アレスチン経路という複数のシグナル伝達経路が働き、既存の $\kappa$ 受容体作動薬はこれら両方の経路を活性化するため、副作用の発現につながるということが知られている。一方、バイアス性 $\kappa$ 受容体作動薬は、鎮痛に寄与するGタンパク質経路を優先的に活性化し、鎮静の副作用発現につながるということが知られている $\beta$ -アレスチン経路の活性化を抑えるという「選択的なシグナル制御」を可能にすることが特徴。

French et al., *Pharmacol Res.* **2022**, *177*, 106091.

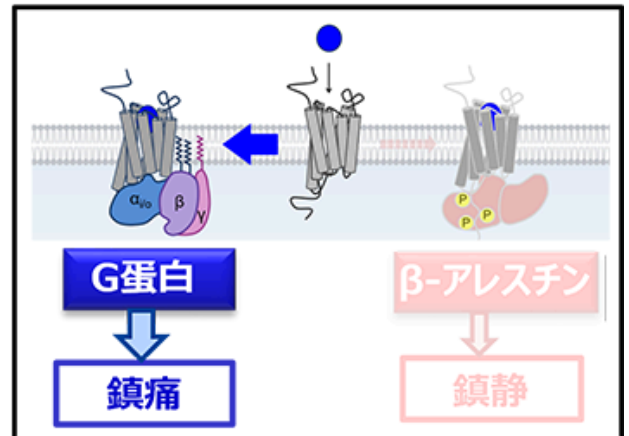
### 既存の $\kappa$ 受容体作動薬 (バイアス性なし)



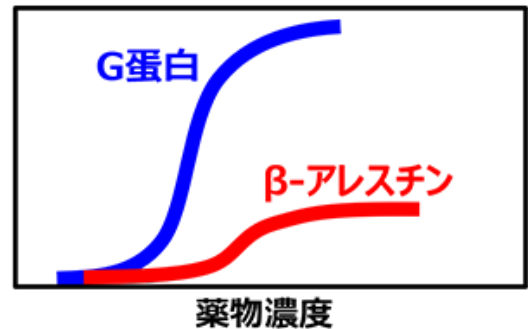
強  
シグナル強度  
弱



### バイアス性 $\kappa$ 受容体作動薬



強  
シグナル強度  
弱



## ※3 早期パートナーシップ戦略

創薬シーズの創出および初期検証を目的とした探索研究に経営資源を集中し、研究開発の早期の段階で、外部の研究機関や企業との提携（共同研究またはライセンスアウト）も推進することにより、探索研究のサイクルを高速化して東レ発の新薬候補・開発パイプラインの継続的な創出・充実を図る戦略。

以上

本事業に関するお問合せ [☎](#)



Copyright © 2026 TORAY INDUSTRIES, INC.

当ウェブサイトでは、お客様のニーズに合ったより良いサービスを提供するために、クッキーを使用しています。[クッキーポリシー](#)