



2010年3月18日

各位

Medicinova, Inc.
代表取締役社長兼 CEO
岩城 裕一
コード番号 : 4875 大証ヘラクレス
問合わせ先 : 東京事務所代表 副社長
岡島 正恒
電話番号 : 03-3519-5010
E-mail : info@medicinova.com

MN-221 の COPD（慢性閉塞性肺疾患）を適応とする

フェーズ 1b 臨床試験の結果のお知らせ

2010年3月17日 米国 サンディエゴ発 - メディシノバ(MediciNova, Inc.) (米国カリフォルニア州 サンディエゴ、代表取締役社長兼 CEO: 岩城裕一) は、MN-221(*1)について、COPD(慢性閉塞性肺疾患) (*2) の治療に対する安全性及び効果を評価するフェーズ 1b 臨床試験において良好な結果を得ましたのでお知らせいたします。本臨床試験は、安定期にある中等度から重度の COPD 患者を対象として行われました。今回の結果により、FEV₁ (1 秒間努力呼気容量) の変化 (パーセント) に臨床的に効果のある改善が認められました。また、本臨床試験において、臨床的に意義のある安全性に関する問題は認められませんでした。

当社は、今回のフェーズ 1b 臨床試験を、安定期にある中等度から重度の COPD 患者約 48 名を対象として行いました。プラセボを対照とする無作為二重盲検比較による用量漸増方式を用いた本臨床試験では、患者は 1 時間にわたる点滴静注により、3 種類の用量 (300 μ g、600 μ g、1200 μ g) の MN-221 またはプラセボの投与を受けました。本結果では、MN-221 の投与を受けたすべての用量の患者群で、ベースライン及びプラセボとの比較において、FEV₁ (容量) に関して臨床的に効果のある改善が認められました。1 時間にわたる点滴静注後の FEV₁ (容量) は、ベースラインとの比較において、MN-221 を 1200 μ g 投与した患者群で平均 21.5% (p=0.0025)、MN-221 を 600 μ g 投与した患者群で平均 16.2% (p=0.020)、MN-221 を 300 μ g 投与した患者群で平均 9.2% (有意差なし) それぞれ増加し、改善が認められました。一方、プラセボを投与した患者群では、FEV₁ に関して平均 4% の低下が見られました。600 μ g または 1200 μ g の MN-221 を投与された患者群では、プラセボとの比較で、最短で 6 時間の効果の持続が認められましたが、これによって、MN-221 が中時間作用型 β 作動薬であることが予想できます。また、MN-221 の投与を受けたすべての患者群において、良好な認容性が認められました。

静注投与により確実に有効濃度の薬剤を体内に届けることができる MN-221 には、COPD に対する従来の標準療法である吸入型の $\beta 2$ アドレナリン作動薬よりも、高い効果が期待できます。当社は、喘息の急性発作に対する適応に加えて、COPD に適応を拡大することにより、MN-221 の市場規模の相当の拡大を見込んでおります。

【MN-221 とは】

MN-221 は、キッセイ薬品工業株式会社が創製した、高い選択性を有する $\beta 2$ アドレナリン・レセプター作動薬であり、当社は同社より日本を除く全世界における MN-221 の開発および販売について独占的なライセンスを取得し、開発を進めております。ライセンスにより取得したデータには、広範な前臨床試験データおよび臨床試験による安全性データが含まれており、生体内外における前臨床試験では、喘息の急性発作治療を目的とする他の $\beta 2$ アドレナリン・レセプター作動薬に比してより高い選択性が確認されております。MN-221 の $\beta 1$ アドレナリン・レセプター作動薬としての心臓に対する作用が限定的であることとともに、従来の選択性の低い $\beta 2$ アドレナリン・レセプター作動薬の問題点である心臓への刺激作用が低減される可能性があると考えられています。また、当社は、静注方法による MN-221 の開発をしておりますが、この投与方法の優れた点は、発作によって狭められた気道を経由せず、有効濃度の薬剤を経静脈的に速やかに肺に届けることができることです。

上記の前臨床データに加え、安定期の軽度から中等度の喘息患者を対象としたフェーズ 2 臨床試験（治験番号 MN-221-CL-004）では、ベースラインからの FEV₁ の平均変化量の増加に直線的な用量相関性が見出されました。すなわち、 $3.5 \mu\text{g}/\text{min}$ 、 $10 \mu\text{g}/\text{min}$ 、 $16 \mu\text{g}/\text{min}$ 、 $30 \mu\text{g}/\text{min}$ 、および $60 \mu\text{g}/\text{min}$ の MN-221 の各投与群において、15 分間投与後の FEV₁ 平均変化量に、有意な改善が認められました（有意差： 10 、 16 、 30 および $60 \mu\text{g}/\text{min}$ ($p \leq 0.0001$) また $3.5 \mu\text{g}/\text{min}$ ($p=0.011$))。また、中等度から重度の喘息患者を対象に行ったフェーズ 2 臨床試験（治験番号 MN-221-CL-005）で、 1.1mg の MN-221 を 1 時間または 2 時間にわたり投与した場合にも、FEV₁ の顕著な改善が認められました。先ごろ完了した喘息の急性発作患者を対象とするフェーズ 2 臨床試験（治験番号 MN-221-CL-006）のデータによれば、標準治療だけを受けた患者群との比較において、標準治療に加えて 15 分間、合計 $240 \mu\text{g}$ から $1,100 \mu\text{g}$ の MN-221 の投与を受けた患者群で、FEV₁ が改善し、さらに、認容性が高いことも明らかになりました。また、すでに完了した、犬を用いた薬物相互作用試験の結果、吸入アルブテロールに、静脈内投与による MN-221 を加えても、アルブテロール単体の吸入に付随する心拍数の増加に変化は見られませんでした。

以上

メディシノバについて

メディシノバ (Medicinova, Inc.) は、日本内外の国際的製薬企業との提携により有望な低分子化合物を導入し、様々な疾患領域の新規医薬品の開発を主として米国で行う公開製薬企業です。弊社のパイプラインには、喘息急性発作、COPD (慢性閉塞性肺疾患)、多発性硬化症を初めとする神経疾患、神経因性疼痛、薬物依存、喘息、間質性膀胱炎、固形癌、全般性不安障害、切迫早産、尿失禁など、多様な疾患の治療を目的とする6つの臨床段階の化合物と、血栓症治療を目的とする2つの前臨床段階の化合物が揃っております。メディシノバは、当面その戦略として、喘息急性発作及びCOPDの治療薬MN-221と多発性硬化症及びその他の中枢神経系疾患治療薬MN-166/AV411との2つの優先的開発化合物に資源を集中して開発を進めていく予定です。MN-221については、米国内で独自に開発を行い、一方MN-166/AV411については、開発に際して、戦略的な提携関係を構築することを考えております。また、他の製品候補につきましても、現金化を試みて参ります。弊社詳細につきましては<http://www.medicinova.jp>をご覧ください。メディシノバの所在地はアメリカ合衆国カリフォルニア州サンディエゴ市ラ・ホイヤ・ヴィレッジ・ドライブ4350、スイート950 (電話 1-858-373-1500)です。

このプレスリリースには、1995年米国民事証券訴訟改革法 (The Private Securities Litigation Reform Act of 1995) に規定される意味での「将来の見通しに関する記述」が含まれている可能性があります。これらの記述には、製品候補の治療法としての新規性および効能を実証する臨床試験に関する記述、既存または将来の臨床試験の計画や目的および製品開発に関する計画または目的に関する記述などが含まれます。このような記述には、臨床試験の結果、現段階の臨床試験の結果が必ずしもその後の製品開発の行方を確定するものではないこと、将来の臨床試験のタイミング、費用、計画など、臨床試験、製品開発および商品化に付随するリスクや不確定要素、FDAに対して書類を提出するタイミング、当社の戦略の失敗、第三者との提携構築、アヴィジェンとの合併により、イブジラストに関する開発プログラムを統合することにより期待される戦略的、財務的メリットを実現する可能性、イブジラストに関する開発プログラムを進めるための戦略的提携交渉、または、資金調達の可能性、知的財産権や契約上の権利を初めとして、当社が米国証券取引委員会に提出した届出書に記載されているものも含めたその他のリスクや不確定要素など、その多くは当社のコントロールが及ばないいくつかの前提、リスク、不確定要素の影響を受けるものであります。したがって、「将来の見通しに関する記述」はその時点における当社の状況を述べているにとどまり、実際の結果または成り行きは、必ずしも予想通りにはならない可能性があることにご留意下さい。また当社には、この記述に関して、情報の修正または更新を行う義務はありません。

ご参考

1. MN-221の詳細については、弊社ウェブサイト

(http://www.medicinova.jp/outline/mn221_2.html) をご覧ください。

2. 慢性閉塞性肺疾患(COPD)とは、長期にわたり、気道が閉塞状態になる病気の総称です。その症状は、主に、息切れやせき・たん、呼吸のたびにゼーゼー鳴る音などで、呼吸を行う臓器である肺がダメージを受け、酸素をとり入れることができないうために起きてきます。さらに進行すると呼吸不全や心不全を起こす命に関わる病気です。別名たばこ病と呼ばれるように、先進国では、原因の90%が喫煙だと言われています。