

各位

メディシノバ・インク  
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](mailto:info@medicinova.com)

## 喘息の急性発作治療薬 MN-221 のフェーズ 2 臨床試験の中間結果のお知らせ

2008年9月9日 米国 サンディエゴ発 - メディシノバ・インク (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、安定期にある中等度から重度の喘息患者を対象に行った喘息発作治療薬 MN-221 のフェーズ 2 臨床試験において、良好な中間結果を得ましたのでお知らせいたします。本臨床試験は、現在、当社が多様な患者群の喘息患者を対象として行っている 2 本のフェーズ 2 臨床試験のうちの 1 本で、本臨床試験から、従来よりも投与時間を長くした場合の MN-221 の有効性と安全性についての情報が得られました。本臨床試験の中間結果は、FEV<sub>1</sub>(1 秒間努力呼気容量)について臨床的に有意な改善を示しております。

本臨床試験は、米国内の 4 ヶ所の施設において、プラセボを対照とする無作為非盲検比較により、2 つの投与群に分けられた 17 名の喘息患者を対象として行っております。一方の投与群は、すべての患者に、1,125 $\mu$ g の MN-221 またはプラセボを、1 時間にわたる点滴静注により投与しました (以下、「前者の投与群」といいます。)。もう一方の投与群では、すべての患者に、1,080 $\mu$ g の MN-221 またはプラセボを、2 時間にわたる点滴静注により投与しました (以下、「後者の投与群」といいます。)。中間結果では、いずれの投与群においても、MN-221 を投与した患者の FEV<sub>1</sub> に、臨床的に有意な、著しい改善が認められました。FEV<sub>1</sub> は、人種、性別、年齢及び身長を補正した標準値基準に基づいた「パーセント予測」値で表しました。前者の投与群では、1 時間の点滴静注終了後、プラセボを投与した患者に 3% の FEV<sub>1</sub> 改善が見込まれているのに対し、MN-221 を投与した患者には、17.5% の FEV<sub>1</sub> の改善が予測されています。

後者の投与群では、2時間の点滴静注後、プラセボを投与した患者に1.4%のFEV<sub>1</sub>改善が見込まれているのに対し、MN-221を投与した患者には、12.1%のFEV<sub>1</sub>の改善が予測されております。本臨床試験の Protokol では、推測統計による検討は行っておりません。また、いずれの投与群においても、MN-221の忍容性は良好でした。本臨床試験により収集された副作用、心電図のデータ、バイタルサインのデータまたは臨床試験評価には、臨床的に重大な安全性の問題は認められませんでした。当社は、今回安定期にある中等度から重度の喘息患者で得られた高い有効性と安全性の結果を、現在実施している急性発作患者を対象とするもう1本のフェーズ2臨床試験のデータとともに解析し、救急施設におけるより大規模なフェーズ2b二重盲検臨床試験(今年冬の開始を目指しております)の設計に使用する予定です。

#### 【MN-221とは】

MN-221は、高い選択性を有するβ2アドレナリン・レセプター作動薬である当社開発化合物です。生体内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β2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β1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β2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。

MN-221のフェーズ2a臨床試験では、用量漸増方式を用い、各用量レベルにおいて、15分間MN-221の投与を受ける群と、プラセボ投与群に無作為に患者(安定期の軽度から中等度の喘息患者)を振り分け、15分間のMN-221静注後のFEV<sub>1</sub>の平均変化を調べました。その結果、実施したすべての用量において、ベースラインからのFEV<sub>1</sub>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 μg/min、10 μg/min、16 μg/min、30 μg/min、および60 μg/minの各投与群において、15分間投与後のFEV<sub>1</sub>平均変化量で、投与量に応じた有意な改善が認められました(有意差:10、16、30および60 μg/min (p ≤ 0.0001) また 3.5 μg/min (p = 0.011))。

当社は、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キッセイ薬品工業株式会社から独占的なライセンスを取得しております。この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ます。当社はまた、切迫早産の治療を目的とするMN-221の開発も行っております。

以上

メディシノバ・インクは、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行う公開製薬企業です。弊社のパイプラインには、臨床段階にある喘息急性発作、多発性硬化症、喘息、間質性膀胱炎、固形癌、全般性不安障害、切迫早産、尿失禁などを適応とする6つの化合物及び前臨床段階にある血栓症を適応とする2つの化合物など、多様な疾患の治療を目的とする化合物が揃っております。弊社詳細につきましては <http://www.medicinova.jp> をご覧下さい。メディシノバ・インク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および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ます。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](http://www.medicinova.jp/outline/mn221_2.html)) をご覧下さい。
2. FEV<sub>1</sub>(1秒間努力呼気容量(一秒量)):呼吸機能検査の測定項目のひとつで、最大の努力で息を吐き出したときに、最初の一秒間で吐き出された息の量をいいます。これが低下すると気道が狭くなっていることを示唆します。
3. β<sub>2</sub> アドレナリン・レセプター:レセプターとは、生体内に存在し、物理・化学的な刺激を受け取る分子やその複合体のことです。このうち気管支平滑筋に存在し、気管支拡張と関連している受容体がβ<sub>2</sub> アドレナリン・レセプターです。これに対してβ<sub>1</sub>アドレナリン・レセプターは、心臓の収縮力や心拍数に関与する受容体です。