



2018年6月22日

各 位

会社名 株式会社デ・ウェスタン・セラピュテクス研究所  
代表者名 代表取締役社長 日高 有一  
(コード番号:4576)  
問合せ先 取締役総務管理部長 川上 哲也  
TEL 052-218-8785

## 「H-1337」の肺高血圧症に関する学会発表のお知らせ

当社が創製し、緑内障治療剤として開発中の「H-1337」につきまして、肺高血圧症における作用効果について、2018年6月22日～23日に開催されております第3回日本肺高血圧・肺循環学会学術集会において発表いたしましたので、お知らせいたします。

主な発表内容は次のとおりで、国立大学法人三重大学と共同で発表しております。  
・肺高血圧症モデルラットに対する新規化合物H-1337の効果

### 【概要】

「H-1337」は動物試験の結果、肺動脈性肺高血圧症の有効な治療薬となる可能性を示した。

「H-1337」は、現在、緑内障・高眼圧症を適応症とした点眼薬として米国第I相/前期第II相臨床試験を進めております。その特徴として、LRRK2<sup>(注1)</sup>を中心とした各種プロテインキナーゼ<sup>(注2)</sup>を阻害するマルチキナーゼ阻害剤<sup>(注3)</sup>であることから、体内にあるプロテインキナーゼに作用する可能性があることが示唆されておりました。2017年9月には、国立大学法人千葉大学（以下、「千葉大学」）と共同研究契約を締結し、肺高血圧症に対する有効性を千葉大学で評価しております。

肺高血圧症は、心臓から肺へ向かう血管（肺動脈）の圧力が高くなる病気です。息切れや呼吸困難といった症状だけでなく、心臓に負担がかかることから進行に伴い右心不全になる可能性がある難病です。その中でも中心的な疾患である肺動脈性肺高血圧症の患者数は約3,000人（国内）と言われており、年々増加傾向にあります。

その治療は主に選択的肺血管拡張薬によりますが、未だその効果は十分とは言えず、新たな機序を有する治療薬の開発が望まれております。

なお、本件による2018年12月期業績予想の変更はありません。

当社は、今後も新薬候補品の創出並びに他疾患の適応拡大に向けた研究開発に取り組み、パイプラインの拡充及びパイプラインの価値向上に努めてまいります。

#### H-1337 について

プロテインキナーゼ阻害剤を中心とする当社化合物ライブラリー<sup>(注4)</sup>のシード化合物を基にして最適化された、緑内障・高眼圧症を適応症とする開発品です。本剤は、LRRK2を中心とした各種プロテインキナーゼを阻害するマルチキナーゼ阻害剤であり、線維柱帯-シュレム管を介して主流出路からの房水流出を促進し眼圧を下降させることが示唆されております。その強力な眼圧下降作用は、長時間持続することが動物試験等で確認されております。

現在、米国第I相/前期第II相臨床試験を進めており、2018年度中に終了する計画をしております。

以上

#### 用語解説

##### (注1)LRRK2 (leucine-rich repeat kinase 2)

キナーゼ活性を持つタンパク質であり、キナーゼ活性の上昇を引き起こす変異が優性遺伝パーキンソン病患者において高頻度で検出されているため、パーキンソン病に関わる重要な分子と考えられています。LRRK2は多くの組織で発現し、眼の線維柱体細胞においても発現が認められており、細胞骨格の制御に関与することが示唆されています。

##### (注2)プロテインキナーゼ

ATP(アデノシン三リン酸と言われ、体内で作られる高エネルギー化合物)等、生体においてエネルギーの元となる低分子物質等のリン酸基を、タンパク質分子に転移する(リン酸化)酵素です。一般にリン酸化を触媒する酵素をキナーゼと呼び、特にタンパク質をリン酸化するキナーゼをプロテインキナーゼと言います。

##### (注3)阻害剤

生体内の様々な酵素分子に結合して、その酵素の活性を低下若しくは消失させる物質を指します。化学物質が特定の酵素の活性を低下若しくは消失させることにより、病気の治療薬として利用されることがあります。

##### (注4)化合物ライブラリー

化合物ライブラリーとは、当社が長年にわたり蓄積してきた新薬候補化合物のタネとなる化合物群です。これらの化合物の一つ一つが特徴的な性質を有しており、基礎研究や新薬候補化合物発見に利用されます。