



2018年9月25日

各 位

会社名 株式会社テ・ウェスタン・セラピ°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

## 緑内障治療剤「H-1337」の米国第I/IIa相臨床試験終了のお知らせ

当社が創製した緑内障治療剤「H-1337」につき、開発委託先である米国の Allysta Pharmaceuticals, Inc. (以下、「Allysta」) が行っていた緑内障・高眼圧症を適応症とした米国第I/IIa相臨床試験(以下、「本試験」)が終了しましたのでお知らせいたします。

本試験では、緑内障・高眼圧症患者を対象に、本剤を投与した際の安全性及び薬物動態の評価、並びに眼圧下降効果の用量反応性を検討し、POC(Proof of Concept: 創薬概念の検証)を取得することを目的としておりました。

現在、試験結果の詳細な解析中であり、今後は、本試験結果を基にオプション契約先である Allysta とライセンス交渉を進めてまいります。なお、本オプション契約は非独占的なものであるため、当社は他社ともライセンス交渉を行うことが可能なため、Allysta との交渉と並行して交渉を進めてまいります。

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。

### 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1)</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<sup>(注2)</sup>を中心とした各種プロテインキナーゼ<sup>(注3)</sup>を阻害するマルチキナーゼ阻害剤<sup>(注4)</sup>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、緑内障治療剤としてだけでなく、肺高血圧症への適応に向けた共同研究を千葉大学と進めております。

以 上

## 用語解説

### (注1)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。

### (注2)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わることが示唆されています。

### (注3)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4)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。