

2024年5月8日

各 位

会 社 名 ラクオリア創薬株式会社
代 表 者 名 代表取締役 武内 博文
(コード番号：4579)
問 合 せ 先 取締役 須藤 正樹
(TEL. 052-446-6100)

新規TRPM8遮断薬の豪州における第 I 相臨床試験開始に関するお知らせ

本日、当社の導出先であるXgene Pharmaceutical Co. Ltd. (昌郁醫藥有限公司；本社：香港、CEO：徐景宏博士、以下「Xgene社」)が、当社がXgene社に導出した新規TRPM8遮断薬 (RQ-00434739/XG2002、以下「本化合物」)につきまして、Xgene社の子会社であるXgene Pharmaceutical Pty Ltd. が、豪州における第 I 相臨床試験 (以下「本フェーズ 1 試験」)の最初の被験者が登録されたことを公表しましたのでお知らせいたします。

TRPM8選択的遮断薬である本化合物は、Xgene社が実施した前臨床試験において、複数の疼痛モデル動物において優れた鎮痛効果を示すとともに良好な安全性プロファイルを示したことから、片頭痛や糖尿病性疼痛などの神経障害性疼痛を含む、様々な急性疼痛および慢性疼痛の治療薬となる可能性を有すると期待されます。

本フェーズ 1 試験では、健康なボランティアを対象とした用量漸増試験により、本化合物の忍容性および薬物動態を評価することで、その後の臨床試験に重要となる情報を取得する予定です。Xgene社の経営陣によるコメント等を含む詳細につきましては、別紙の同社プレスリリース (翻訳) をご覧ください。

当社は、Xgene社とのライセンス契約に基づき、開発段階に応じたマイルストーンおよび、製品発売後に製品の売上高に応じたロイヤルティを受け取る権利を保有しています。本件に伴い当社が受け取る一時金はなく、2024年12月期 (2024年1月1日～2024年12月31日)の通期連結業績への影響はございませんが、Xgene社による開発の進展は当社が創出したTRPM8遮断薬の中長期的な価値向上に資するものと考えております。

当社は今後も引き続き、Xgene社との連携のもと、疼痛治療の新たな選択肢の提供を通じて痛みを苦しむ患者さんのQOLの向上に一層貢献できるように努めるとともに、当社の企業価値の向上を図ってまいります。

以 上

<ご参考>

【Xgene社について】

Xgene Pharmaceutical Co. Ltd. およびXgene Pharmaceutical Pty Ltd. は、Xgene Pharmaceutical Inc. (本社：ケイマン諸島、CEO：徐景宏 博士) の子会社です。Xgene Pharmaceutical Inc. は、2015年の設立以来、神経疾患領域における未充足のニーズを満たす画期的な治療薬の開発に取り組んでいます。同社のアプローチは、独自のリンカー技術を駆使して、疼痛やその他の神経疾患の治療のための新規のマルチモーダルな共役分子を創製するというものです。同社は、疼痛治療薬の有効性と忍容性の改善に焦点を当て、後期臨床段階のみならず探索および前臨床開発段階のプログラムからなるパイプラインを保有しています。詳細は同社のホームページ <https://xgenepharm.com> (英語サイト) をご覧ください。

以下の資料は、Xgene 社が同社ウェブサイトにて 2024 年 5 月 8 日（現地時間）付で公表した資料の日本語翻訳です。この資料の正式言語は英語であり、内容および解釈については英語が優先します。

Xgene Pharmaceutical Pty Ltd. 新規選択的TRPM8遮断薬XG2002カプセルの

第 I 相臨床試験における最初の cohorts の登録を発表

2024年5月8日、Xgene Pharmaceutical Pty Ltd.は、疼痛受容体TRPM8の選択的遮断薬であり、新規かつ経口投与可能な低分子化合物であるXG2002のカプセル製剤を用いた第I相臨床試験（以下「本フェーズ1試験」）の最初の cohort^{※1} が登録されたことを発表しました。本フェーズ1試験は、オーストラリアのCMAX Research Centerにおいて実施される単回投与用量漸増試験であり、健康なボランティアを対象として、XG2002の安全性、忍容性、薬物動態プロファイルおよび最大耐容量を評価することを目的としています。

[TRPM8について]

TRPM8は末梢感覚ニューロンに発現するイオンチャンネルです。TRPM8が活性化されると細胞内にNa⁺イオンとCa²⁺イオンが流入し、ニューロンの脱分極を引き起こされ活動電位が発生します。このシグナルがニューロン間で伝達されることで最終的に痛みの感覚をもたらします。神経障害性疼痛、化学療法誘発性疼痛、複合性局所疼痛症候群、膀胱痛症候群など、様々な疼痛症状において、TRPM8の発現と感受性が高まっていることが数多くの研究で示されています。さらに、TRPM8は、様々ながん細胞でも高発現しています。TRPM8はアンドロゲン依存性のCa²⁺チャンネルであり、前立腺がん細胞の生存と密接に関連していることから、がん治療のターゲットとしても有望視されています。

Xgene Pharmaceutical Pty Ltd.がラクオリア創薬から導入したXG2002は、TRPM8の阻害により、様々な疼痛モデル動物において鎮痛効果を示した上、良好な安全性プロファイルを持つ化合物です。本フェーズ1試験は、XG2002の安全性、忍容性および薬物動態プロファイルを健康なボランティアにおいて評価することを目的としています。これにより、多様な疼痛関連疾患における今後の可能性を検討する土台を築くことを意図しています。

Xgene Pharmaceutical Pty Ltd.の最高医学責任者（CMO）兼シニア・バイス・プレジデントであるLeon Jiang博士は、安全で効果的な鎮痛薬に関するアンメット・クリニカル・ニーズ^{※2} の大きさについて次のように述べています。様々な疼痛症状においては、それぞれ異なる痛覚経路が働いています。このため、幅広い範囲の疼痛症状に的確に対処するためには、作用機序の異なる多種多様な薬剤が必要です。今回の被験者登録開始は、XG2002の臨床開発における重要なマイルストーンであり、急性および慢性の疼痛管理に対する新たな治療オプションの創出においても重要な意味を持ちます。

Xgene Pharmaceutical Pty Ltd.の共同設立者であり、最高執行責任者（COO）兼最高科学責任者（CSO）で

あるFeng Xu博士は、TRPM8が痛覚伝達において極めて重要な役割を果たすとともに、その他の多様な病態と関連していることを強調しました。同氏は、XG2002が安全性と有効性に優れた新規のTRPM8遮断薬として将来の臨床応用への道を切り拓く存在になるとの確信を表明しました。

Xgene Pharmaceutical Pty Ltd.の創設者兼CEOであるGene Hsu博士は、同社が患者第一の姿勢のもとで疼痛管理における医療ニーズの解決にコミットしていることであらためて言及し、同社が幅広い急性および慢性疼痛症状に対する安全かつ効果的な治療法の開発に焦点を当て、独自の薬物複合体プラットフォームの活用と新たな治療標的の探索に取り組んでいることを強調しました。

[Xgene社について]

Xgene Pharmaceutical Pty Ltd.はXgene社の子会社で、オーストラリアに登録されています。Xgene Pharmaceutical Inc.は、ベンチャーキャピタルの支援を受けた臨床開発段階を専門とする国際的な企業であり、独自のリンカー技術を駆使して、疼痛やその他の神経疾患の治療のための新規のマルチモーダルな複合体分子^{※3)}を創製しています。Xgene社独自のリンカー技術は、既存の薬剤や新規に創製された薬剤のプロファイルに合わせて調整され、マルチモーダルな薬物を組み合わせるアプローチの課題を克服し、より優れた、安全かつ効率的な治療法を提供します。同社は、疼痛治療薬の有効性と忍容性の改善に焦点を当て、後期臨床段階のみならず探索および前臨床開発段階のプログラムからなるパイプラインを保有しています。同社は、Morningside Capital社、TF Capital社、Ping'an Venture Capital社、Hengxu Capital社、CITIC Securities社などの大手の機関投資家から評価され、支援を受けています。

[用語説明] (本用語説明はラクオリア創薬株式会社にて追加したものです)

※1) コホート：調査対象とするグループのことを指します。コホート研究とは、臨床試験においてある薬を飲んでいる集団と飲んでいない集団に分類し、比較分析からその集団間にある因果関係を調べる研究を指します。

※2) アンメット・クリニカル・ニーズ：アンメット・メディカル・ニーズともいい、いまだ満たされていない医療ニーズ、つまり、いまだ有効な治療法がない疾患に対する医療ニーズのことを指します。医学が進歩した現在でもなおアンメット・クリニカル・ニーズ（アンメット・メディカル・ニーズ）は数多く存在しています。

※3) マルチモーダルな複合体分子：Xgene社のいう”multimodal, conjugate molecules”の訳語です。マルチモーダルとは、マルチ＝複数、モーダル＝形式・手段をつなげた用語です。また、複合体とは、2つの分子や物質が組み合わさった状態を表しています。ここでは複数の部位と作用メカニズムによって働く分子が想定されま