

2018年7月20日

各 位

会 社 名 わかもと製薬株式会社  
代表者名 代表取締役社長 堀尾 良宏  
(コード:4512、東証第一部)  
問合せ先 広報室長 福原 和彦  
(TEL 03-3279-0334)

緑内障・高眼圧症治療剤「WP-1303 (H-1129)」の  
国内第II相臨床試験終了のお知らせ

わかもと製薬株式会社(本社:東京、代表取締役社長 堀尾 良宏、以下「わかもと製薬」)は、株式会社デ・ウエスタン・セラピテクス研究所(本社:愛知、代表取締役社長 日高 有一、以下「DWTI」)が創製したRhoキナーゼ(ROCK:Rho-associated, coiled-coil containing protein kinase)を含む多様なプロテインキナーゼ阻害剤<sup>1-2)</sup>(H-1129)を用いた当社開発コード、WP-1303(以下「本剤」)の緑内障・高眼圧症を適応症とした国内第II相臨床試験が終了したことをお知らせ致します。

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眼圧下降効果とその用量反応性及び安全性についてプラセボ<sup>3)</sup>を対照に検討致しました。その結果、眼圧下降効果を示され、安全性についても良好な結果が得られました。

現在、本試験結果に基づき、国内第III相臨床試験開始に向けて準備を進めております。

本剤は、各種プロテインキナーゼを阻害する他に、熱ショックタンパク質<sup>4)</sup>のHsp90に結合することが確認されており、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。

WP-1303 (H-1129) について

DWTI が保有するプロテインキナーゼ阻害剤を中心とした化合物ライブラリー<sup>5)</sup>から見出された新薬候補化合物であり、当社が2013年3月にライセンス契約を締結し、緑内障・高眼圧症を適応症とした非臨床試験を進め、2017年8月より国内第II相臨床試験を開始しておりました。

以 上

## 用語解説

### 1) 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。

### 2) 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。

### 3) プラセボ

偽薬とも呼ばれており、有効成分が含まれていない薬のことを言います。

### 4) 熱ショックタンパク質

細胞が熱等のストレス条件下にさらされた際に発現が上昇することで細胞を保護するタンパク質の一群であり、「Hsp90」などのように、それぞれの分子がその分子量に基づいて名づけられています。

### 5) 化合物ライブラリー

化合物ライブラリーとは、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いる可能性があり、基礎研究や新薬候補化合物発見に利用されます。