

参考資料

2008年6月17日

当参考資料は、F. ホフマン・ラ・ロシュおよびイプセンが2008年6月10日（スイス現地時間）に発表した英文プレスリリースを、戦略的アライアンスを締結している中外製薬が翻訳版として、報道関係者の皆様に提供させていただくものです。

従いまして、日本国内と状況が異なる場合があること、また、正式言語が英語であるため、表現や内容につきましては英文プレスリリースが優先されますことをご留意下さい。

英文プレスリリースは、<http://www.roche.com/home/media/med-cor.htm>をご参照下さい。

Taspoglutide (R1583) について

- ・国内では、II型糖尿病を適応として帝人ファーマ株式会社と共同で臨床試験を実施中です。

2008年6月10日 バーゼル発

ロシュの糖尿病治療薬 Taspoglutide が第Ⅲ相臨床試験に移行

ロシュとイプセンは週1回投与型としては初となるヒト GLP-1 の第Ⅱ相臨床試験の肯定的な結果を米国糖尿病協会の年次総会において発表

ロシュとイプセンの糖尿病治療薬Taspoglutideの忍容性と有効性はII型糖尿病の患者さんの治療においておおむね良好であり、わずか8週間の治療で著明な血糖コントロール改善作用および体重減少作用が示されました^{注1,2}。Taspoglutideは、イプセンの研究から創製された週1回投与型としては初めてのヒトグルカゴン様ペプチド1（GLP-1）類似化合物で、血糖調節に重要な役割を果たしている天然ホルモンGLP-1に類似した化合物です。米国サンフランシスコで開催された米国糖尿病協会（American Diabetes Association : ADA）の年次総会に発表された第Ⅱ相臨床試験の有望な結果を受けて、ロシュはTaspoglutideを第Ⅲ相臨床試験に移行させる決定を下しました。なお、このプログラムは2008年下半期に開始が見込まれています。

「これらのデータはII型糖尿病におけるGLP-1の役割を強固にするものであり、Taspoglutideがこれまでにない治療薬となる可能性をロシュとイプセンは信じています」と、ロシュ医薬品事業 CEO のウィリアム M. バーンズとイプセングループ会長兼 CEO のJean-Luc Bélingardは語りました。さらに、「GLP-1類似化合物はインスリン分泌を促すとともにグルカゴン分泌を抑制するもので、糖尿病領域における全く新しい治療薬です。ロシュとイプセンはこのこれまでにない治療薬となる可能性がある製品を第Ⅲ相臨床試験に移行できることを喜ばしく思い、また、この製品を市場に送り込むよう協働していくことを望んでいます」と、両氏は続けました。

第Ⅱ相臨床試験では、イプセンの研究から創製されたTaspoglutideに報告のあった最も頻度の高い有害事象は軽度ないし中等度の悪心であることが示され、このTaspoglutideの安全性プロファイルが第Ⅲ相臨床試験への移行を裏付けています^{注1,2}。これらの事象は用量依存的で、ほとんどの場合で治療継続中に自然に消失しました。

「これらのデータは、Taspoglutide が経口糖尿病治療薬ではもはやコントロールできないⅡ型糖尿病肥満の患者さんに対する有望かつ極めて効果の高い週1回投与型治療薬であることを示しています」と、筆頭著者であり Diabeteszentrum Bad Lauterberg (ドイツ) 所長を務める Michael Nauck 教授は語りました。さらに、「このタイプの患者にとっては、血糖コントロール改善だけでなく、薬物による体重減少も特に有益となります。我々は第Ⅲ相臨床試験の結果を興味深く待ちたいと思います」と続けました。

ロシュは、イプセンから取得した Taspoglutide に関するライセンスのオプション権を 2006 年に行使し、帝人ファーマとの共同開発・販売権が既定されている日本、およびイプセンが共同販売権の保有を選択できるフランスを除く全世界での Taspoglutide の独占的開発・販売権を獲得しました。

試験について

メトホルミン治療Ⅱ型糖尿病 (T2DM) 患者さんに対する長時間作用型ヒトGLP-1 類似化合物 Taspoglutide を用いた 8 週間治療による、血糖コントロール改善、体重減少：二重盲検プラセボ比較対照第Ⅱ相臨床試験^{注1}

- ・メトホルミンでは適切にコントロールできなかったⅡ型糖尿病患者さんにおける Taspoglutide の有効性、安全性、および忍容性を評価しました。
- ・プラセボもしくは 5 mg、10mg、または 20 mg 週 1 回 (QW) か 10mg および 20mg 隔週 1 回 (Q2W) の Taspoglutide による 8 週間治療に患者さん 306 例を無作為に割り付け、最終投与からさらに 4 週間追跡調査しました。
- ・プラセボ投与群に比べ HbA1c の有意な減少が治療 8 週間後に観察されました。試験終了時に目標の HbA1c 7%以下を達成した患者のパーセンテージはプラセボ投与群の 17%に対し 5 mg、10mg、20mg 週 1 回投与群でそれぞれ 59%、79%、81%で、10mg および 20mg 隔週 1 回投与群でそれぞれ 44%および 63%でした。
- ・体重は継続的かつ用量依存的に減少し、10mg および 20 mg QW 投与群および 20mg Q2W 投与群ではベースラインから有意に減少しました。
- ・最も頻度の高い有害事象は用量依存的で一過性の軽度ないし中等度の悪心でした。本試験では膵炎エピソードの報告はありませんでした。

メトホルミン治療糖尿病患者さんにおける高用量の長時間作用型ヒトGLP-1 類似化合物 Taspoglutide の安全性および忍容性：二重盲検プラセボ比較対照第Ⅱ相臨床試験^{注2}

- ・メトホルミンでは適切にコントロールできなかったⅡ型糖尿病患者さんにおける Taspoglutide の用量増の安全性および忍容性を評価しました。
- ・患者さん 133 例のうち 129 例がプラセボまたは Taspoglutide 20mg の 4 週間の投与を受けた後、続けてプラセボ投与、20mg (20/20 投与群) 週 1 回での維持投与、または 30mg 週 1 回 (20/30 投与群) か 40mg 週 1 回 (20/40 投与群) への増量投与をさらに 4 週間受ける群に無作為に割り付けました。最終投与から 4 週間追跡調査しました。

- ・実薬投与群すべてに血糖コントロールの有意な改善が観察されました。治療終了時に7%以下のHbA_{1c}に達した患者のパーセンテージはプラセボ投与群の19%に対し20/20投与群、20/30投与群、および20/40投与群でそれぞれ72%、53%および70%でした。
- ・予想通り、最も頻度の高い有害事象は軽度ないし中等度の一過性の悪心で、ほとんどの場合、治療の早期に発現し、治療継続中に自然に消失しました。本試験では膵炎エピソードの報告はありませんでした。

Taspoglutide (R1583) について

Taspoglutideは週1回投与長時間作用型ヒトグルカゴン様ペプチド1 (GLP-1) アナログのファミリーから選別され、固有の徐放性を発揮する構造修飾を有します。イプセンは、治療用のペプチドおよびタンパク質に応用されるマトリクスフリー徐放性製剤の概念の提唱者です。II型糖尿病は多くの先進国において第4位の死亡原因であり、TaspoglutideはII型糖尿病の患者さんへの画期的な新規治療薬として開発されています。Taspoglutideの分子構造はヒト天然ホルモンGLP-1のそれと類似しており、マトリクスを使用しなくても最大2週間の投与間隔を空けることが可能です。Taspoglutideは現在第III相臨床試験に移行中です。

糖尿病について

糖尿病は、インスリン分泌能の障害および/またはインスリン抵抗性による過剰な血糖を特徴とする疾患です。II型糖尿病が世界中の全糖尿病患者の90%~95%を占めており、多くの場合で成人に発症します。冠動脈および末梢血管疾患、脳卒中、糖尿病性神経障害、四肢切断、腎不全、失明など糖尿病に起因する合併症により、ほとんどすべての地域社会において障害の増加、平均余命の短縮、および莫大な医療費が生じています。世界保健機関による最新の推計によると、糖尿病の患者数は2025年までの今後20年間で2倍以上に増え、3億人を超えると見られています。

ロシュについて

ロシュは、スイスのバーゼルに本社を置く医薬品および診断薬領域における研究開発型の世界的ヘルスケア企業です。ロシュ・グループは、世界最大のバイオテクノロジー企業であり、疾病の早期発見、予防、診断、治療のための革新的製品やサービスのサプライヤーとして、人びとの健康とQOLの改善に多方面で貢献しています。診断薬事業、がんおよび移植領域の医薬品で世界第1位、ウイルス感染症領域ではマーケットリーダーです。さらに、自己免疫疾患、炎症、代謝および中枢神経系などの主要な治療領域でも活躍しています。2007年度の売上は、医薬品事業では368億スイスフラン、診断薬事業では93億スイスフランでした。また、ロシュは世界各国に約79,000人の社員を擁し、多数のパートナー企業と研究開発契約や戦略的アライアンスを締結しており、ジェネンテックと中外製薬の株式の過半数を保有しています。また、研究開発費に約80億スイスフランを投資しています。ロシュ・グループに関するさらに詳しい情報はwww.roche.comをご覧ください。

イプセンについて

イプセン社は、画期的な医薬品製造に特化した国際的な専門製薬グループであり、販売されている製品は20種を超え、スタッフの合計は世界中でほぼ4,000人に上ります。イプセンの開発戦略は、成長牽引役を担う標的治療領域（腫瘍学、内分泌学、神経筋障害）における専門製品と研究資金調達に大きく貢献するプライマリケア製品との組み合わせを基盤にしています。イプセンの4つの研究開発センターがパリ、ボストン、バルセロナ、ロンドンに位置することや、ペプチ

ドやタンパク質の工学的基盤が、イプセングループの競争力となって、最先端の大学研究チームおよび質の高い人材にアクセスできるのです。700名を超える研究開発スタッフが患者さんのケアに画期的な医薬品の発見および開発に取り組んでいます。また、この戦略は闊達なパートナーシップ方針によっても支えられています。2007年、研究開発費用は連結売上の20%を超える約1億8,500万ユーロでしたが、連結売上は合計で9億2,050万ユーロに達し、総収益は合計で9億9,380万ユーロに達しました。イプセンの株式はEuronextTMによるEurolistのセグメントA（株式コード：IPN、ISINコード：FR0010259150）にて取り引きされています。イプセンの株式は「Service de Règlement Différé, SRD（決済繰り延べ）」の資格を有し、イプセングループはユーロネクストのSBF 120 指標銘柄となっています。イプセンに関する詳細な情報については、ウェブサイト（www.ipsen.com）をご覧ください。

本プレスリリースに使用された商標等はすべて法律で保護されています。

追加情報

II型糖尿病：http://www.health-kiosk.ch/start_diabetes

参考文献

- 注1. Eight Weeks of Treatment with the Long-Acting, Human GLP-1 Analogue R1583 Improves Glycemic Control and Lowers Body Weight in Subjects with Type 2 Diabetes Mellitus (T2DM) Treated with Metformin: A Double-Blind Placebo-Controlled Phase 2 Study. Abstract number A-1604 Presented on June 7th 2008 at the 68th Scientific Session of the American Diabetes Association, San Francisco, U.S.
- 注2. Safety and Tolerability of High Doses of the Long-Acting, Human GLP-1 Analogue R1583 in Diabetic Subjects Treated with Metformin: A Double-Blind, Placebo-Controlled Phase 2 Study. Abstract number A-2434. Presented on June 9th 2008 at the 68th Scientific Session of the American Diabetes Association, San Francisco, U.S.

イプセンの見通し情報

このプレスリリースに含まれる見通し情報および目標は、イプセンの経営幹部による最新の見解と仮定に基づいています。当該情報には、本プレスリリースの予測とは大きく異なる実績、業績、事象を生じうる既知や未知のリスクおよび不確実性が含まれます。さらに、研究開発プロセスはいくつかのステージで構成され、各ステージでイプセングループが目的を達成できないことや相当な金額を投資してきた製品への取り組みを断念せざるを得ないという大きなリスクが存在します。したがって、イプセングループは、前臨床試験の段階で得られた有望な結果がその後の臨床試験の段階で確認されること、または臨床試験の結果が当該製品の安全性および有効性を十分に示すこと、または規制当局がイプセンにより提供されるデータおよび情報に了解することについては確定できません。イプセンは、適用法に既定されていない限りは、当該情報の基礎となる事象、条件、仮定、または状況における変更を反映させるために本プレスリリースに含まれる見通し情報、目標、推算を更新や改訂するいかなる義務および約束も負わないことを明記します。イプセンの事業は Autorité des Marchés Financiers（フランス金融市場庁）に申請された情報文書に概略されるリスク因子の対象となります。