

2004年11月1日

各位

新規エイズ治療薬（経口 CCR5 受容体拮抗剤）前期第 相臨床試験を終了

小野薬品が創製し、2002 年末に英国グラクソ・スミスクライン社（GSK 社）に導出した新規エイズ治療薬（開発記号：ONO-4128 / 873140）の前期第 相臨床試験が終了し、その試験成績が、2004 年 10 月 30 日から 11 月 2 日にかけて米国で開催されている第 44 回抗菌薬および化学療法に関する学会（ICAAC：Interscience Conference on Antimicrobial Agents and Chemotherapy）において発表されましたので、その内容について概略をお知らせします。

当該試験では、未治療および治療経験のある成人 HIV 感染患者 40 名を対象に「ONO-4128 / 873140」を短期間、単剤として投与し、抗ウイルス効果、安全性、薬物動態および本剤の CCR5 受容体との結合性（受容体占有率）を検討しております。

具体的には、成人 HIV 感染患者 40 名を本剤「200mg の 1 日 1 回投与」「200mg の 1 日 2 回投与」「400 mg の 1 日 1 回投与」および「600 mg の 1 日 2 回投与」のいずれかの群に均等に分け、各群において 10 名を対象に実薬または偽薬（8 名が実薬、2 名が偽薬）を 10 日間投与し、投与開始後 24 日目まで観察を行いました。

抗ウイルス効果については、投与前後の血漿中ウイルス量の変化で評価しております。

偽薬を投与した患者さんでは、投与前後のウイルス量は殆ど変化しませんでした。また、「200mg の 1 日 1 回投与」では約 1/3 に、「200mg の 1 日 2 回投与」では約 1/17 に、「400 mg の 1 日 1 回投与」では約 1/11 に、そして「600 mg の 1 日 2 回投与」では約 1/46 にウイルス量が減少しました。

有害事象としては、投与の比較的初期に、軽度の消化器症状（胃腸障害）が見られた程度で、心電図や臨床検査値で特に問題となるような所見は認められませんでした。

また、本剤投与期間中における受容体占有率は全ての投与群で 90%以上でありましたが、投与終了後は用量依存的に占有率が低下することが分かりました。

これらの結果は、「ONO-4128 / 873140」の強力な抗ウイルス作用と高い安全性を立証しており、今後、実施する後期第 相臨床試験および第 相臨床試験を強く支持するものであります。GSK 社は、年内にも次のステップに移行する予定です。

小野薬品工業株式会社  
広報室  
TEL：06-6263-5670  
FAX：06-6263-2950

(参考資料)

## 化合物のプロファイル

< ONO-4128 / 873140 : CCR5 受容体拮抗剤 >

本剤は、HIV ウィルスが細胞に侵入する際に利用する重要な受容体の一つと考えられている CCR5 受容体に拮抗することで、ウィルスの細胞内への侵入を防ぐという既存の薬剤とは異なる新しい作用機序の薬剤です。

また、本剤の標的である CCR5 受容体は免疫細胞に存在するため、既存の薬剤と異なり、変異ウィルスの出現による薬剤耐性の可能性も低いと考えられています。

健康成人を対象とした第 Ⅰ 相臨床試験および成人 HIV 感染患者を対象とした前期第 Ⅰ 相臨床試験の結果、本剤の安全性が確認されました。また、本剤がヒトの CCR5 受容体に長時間結合するという重要な薬理作用が確認されておりますことから、1 回の服用量が少なく、また 1 日の服用回数も少ない薬剤として開発できるものと期待しています。