

2023年12月5日

各 位

会 社 名 株式会社レナサイエンス  
代表者名 代表取締役社長 内藤 幸嗣  
(コード:4889 東証グロース)  
問合せ先 管理部  
(TEL. 03-6262-0873)

**当社 PAI-1 阻害薬の新規用途特許**  
**(発明の名称：免疫チェックポイント分子の発現抑制剤) 登録のお知らせ**

この度、当社が出願しておりました用途特許について、下記の通り日本において特許が登録されることになりましたのでお知らせします。

発明の名称 : 免疫チェックポイント分子の発現抑制剤  
地域 : 日本  
出願番号 : 特願 2021-551413  
登録番号 : 未定  
出願人 : 株式会社レナサイエンス

がんの治療の基本は、①外科的療法、②放射線療法、③化学療法（抗がん剤）、④免疫療法です。人体は、外来のウイルス、細菌、微生物から体を守る免疫というシステムを持っていますが、体内には過剰な免疫を抑制する免疫チェックポイント分子<sup>\*1</sup>というブレーキが備わっています。がんはこの免疫チェックポイント分子を悪用することで自分自身に対する免疫が働かないようにしています。代表的な免疫療法である免疫チェックポイント阻害薬<sup>\*2</sup>は、この免疫チェックポイント分子を阻害することで、ブレーキを解除して免疫ががんを攻撃できるようにします。

当社は、プラスミノージェンアクチベーターインヒビター1（PAI-1）が免疫チェックポイント分子を介してがん免疫を阻害することを発見しました。実際に動物モデルを用いた非臨床試験で、当社が開発した PAI-1 阻害薬 RS5614 を経口投与することで悪性黒色腫、大腸がん、肺がんなどのがんが退縮すること、さらに免疫チェックポイント阻害薬であるニボルマブとの併用でこの作用は著しく増強されることが分かりました。これら知見に基づき、悪性黒色腫の第Ⅱ相試験を終了し（2023年8月16日開示）、非小細胞性肺がん（令和5年9月26日適時開示）や血管肉腫（2023年10月26日開示）の第Ⅱ相試験を実施中です。

本特許は、免疫チェックポイント阻害薬としての当社 PAI-1 阻害薬の医薬用途に関する発明を保護します。当社はこれまでに日本、米国、欧州をはじめとした各国において、RS5614 を含む PAI-1 阻害薬の特許（物質特許、用途特許、用法用量特許）を取得しています。本特許により、RS5614 を含む PAI-1 阻害薬の特許がさらに強化され、また特許期間の延長（10 年）が可能となります。

なお、本件による業績への影響は現時点では特にありません。

以 上

\*1 免疫チェックポイント分子

免疫の恒常性を保つために、自己に対する免疫応答を阻害し過剰な免疫反応を抑制する分子群です。免疫チェックポイント分子はリンパ球の過剰な活性化を抑制して自己を攻撃させないために存在しますが、がん細胞は免疫系からの攻撃を回避するために免疫チェックポイント分子を悪用します。現在、PD-1、CTLA-4 などさまざまな免疫チェックポイント分子が同定されています。

\*2 免疫チェックポイント阻害薬

免疫チェックポイント分子の作用を阻害する医薬品で、現在治療薬として用いられている薬剤はすべて免疫チェックポイント分子に直接結合し、それを阻害する抗体医薬です。