

NLS Pharmaceuticals anuncia nuevos datos in vitro que confirman el mecanismo de acción dual único de Quilience(R) (Mazindol ER), que implica una actividad significativa del receptor de orexina-2

Se cree que el déficit de orexina es la causa fundamental de la narcolepsia. Mazindol ER es el agonista parcial de los receptores de orexina-2 más avanzado en desarrollo para el tratamiento de la narcolepsia y otros trastornos raros del sueño. Mazindol ER es el primero en su clase, con un mecanismo de acción dual único como inhibidor de la recaptación de la pan-monoamina y un potente agonista parcial de los receptores de Orexina-2

Los ensayos clínicos de fase 2 que evalúan Quilience (mazindol ER) en el tratamiento de la narcolepsia han concluido recientemente, cumpliendo el criterio de valoración primario con una elevada significación estadística.

NLS Pharmaceuticals Ltd. (NASDAQ:NLSP)(NASDAQ:NLSPW) ("NLS" o la "Compañía"), una compañía biofarmacéutica suiza en fase clínica centrada en el descubrimiento y desarrollo de terapias innovadoras para pacientes con trastornos raros y complejos del sistema nervioso central, ha anunciado hoy nuevos resultados de estudios in vitro que demuestran el efecto agonista de mazindol ER en el Receptor Orexin-2 (OX2R). Dos estudios idénticos que midieron diferentes concentraciones de mazindol ER confirmaron una actividad agonista parcial significativa del OX2R a 30 nM o más. Notablemente, los hallazgos muestran que el mazindol ER mostró una fuerte actividad agonista parcial del OX2R por ensayos funcionales celulares y de receptores nucleares. Los resultados mostraron valores de pEC50 (una medida logarítmica de la potencia del fármaco que expresa una concentración que es eficaz para producir el 50% de la respuesta máxima) de 4,7 a 5 para el mazindol en el OX2R, lo que indica un fuerte agonista parcial del OX2R.

La orexina, también conocida como hipocretina, es un neuropéptido que regula la excitación, la vigilia y el apetito. La orexina desempeña un papel fundamental en la regulación del ciclo sueño-vigilia y la forma más común de narcolepsia, el tipo 1 (NT1), en la que el individuo experimenta breves pérdidas de tono muscular, conocidas como cataplejía, está causada por la falta de orexina en el cerebro debido a la destrucción de las células que la producen. Mazindol ER es un agonista parcial de OX2R desarrollado para tratar la pérdida de señalización de la orexina en la NT1. Los tratamientos disponibles actualmente para la NT1 sólo abordan los síntomas asociados, pero no la pérdida subyacente de orexina.

"Este resultado es muy alentador para comprender el mecanismo de acción de mazindol ER en el tratamiento de la narcolepsia", dijo Eric Konofal, MD, PhD, Director Científico de NLS Pharmaceuticals. "Se trata de una importante opción terapéutica adicional en la narcolepsia de tipo 1, que incluye somnolencia diurna excesiva y pérdida repentina del tono muscular, o cataplejía, cuando la persona está despierta. Ahora sabemos que se considera que la orexina desempeña un papel crucial en el ciclo sueño-vigilia y que la narcolepsia está causada por una pérdida grave del neurotransmisor orexina en

el hipotálamo lateral".

Actualmente se están llevando a cabo otros estudios preclínicos in vivo para confirmar la actividad del OX2R. Un estudio piloto en el modelo animal de ratones OXR2 KO se comparó favorablemente con el fármaco en investigación TAK-925, un agonista del receptor de orexina 2. En el primer semestre de 2023 están previstos estudios complementarios para caracterizar con más detalle la actividad en OX2R, así como en OX1R. NLS Pharmaceuticals tiene previsto presentar los resultados del estudio en una reunión científica a finales de este año.

"El mecanismo de acción dual único de mazindol ER parece representar una ventaja sobre los compuestos estudiados previamente, ya que mazindol ER parece ser altamente eficaz en la reducción de los síntomas de la narcolepsia sin los efectos secundarios potenciales de un agonista OX2R completo. Somos muy optimistas respecto a estos estudios combinados con los prometedores resultados de nuestro programa de fase 2", declaró Alex Zwyer, Consejero Delegado de NLS Pharmaceuticals.

El programa de fase 3 para Quilience (mazindol ER) está actualmente en vías de comenzar a mediados de 2023.

Acerca de NLS Pharmaceuticals Ltd.

NLS Pharmaceuticals Ltd. (Nasdaq: NLSP) es una compañía biofarmacéutica global en fase de desarrollo, que trabaja con una red de socios de clase mundial y científicos reconocidos internacionalmente, centrada en el descubrimiento y desarrollo de terapias innovadoras para pacientes con trastornos raros y complejos del sistema nervioso central, o SNC, que tienen necesidades médicas no cubiertas. Con sede en Suiza y fundada en 2015, NLS está dirigida por un equipo directivo experimentado con un historial de desarrollo y comercialización de productos candidatos.

Para más información, visitar www.nlspharma.com.

Acerca de Quilience

El principal candidato a producto de la empresa, Quilience®, es una formulación patentada de liberación prolongada de mazindol (mazindol ER) y se está desarrollando para el tratamiento de la narcolepsia, y potencialmente otros trastornos del sueño-vigilia como la hipersomnia idiopática (IH), para la que NLS obtuvo recientemente la designación de enfermedad huérfana (ODD) de la Administración de Alimentos y Medicamentos de los Estados Unidos (FDA) y la Agencia Europea de Medicamentos (EMA). El mazindol es un triple inhibidor de la recaptación de monoaminas y agonista parcial del receptor de orexina-2, que se utilizó durante muchos años para tratar a pacientes diagnosticados de narcolepsia en programas de uso compasivo. Un estudio clínico estadounidense multicéntrico de fase 2 en el que se evaluó Quilience® en pacientes adultos con narcolepsia alcanzó su objetivo primario con una elevada significación estadística y demostró un perfil favorable de seguridad y tolerabilidad. NLS también completó con éxito un estudio de fase 2 en EE.UU. sobre Nolazol® (Mazindol de liberación controlada) en pacientes adultos con TDAH. El estudio cumplió todos los criterios de valoración primarios y secundarios y Nolazol® fue bien tolerado. Quilience® ha recibido la designación de medicamento huérfano tanto en EE.UU. como en Europa para el tratamiento de la narcolepsia. Hasta un tercio de los pacientes narcolépticos también están diagnosticados de TDAH.

Datos de contacto:

Marianne Lambertson
+1 239.682.8500

Nota de prensa publicada en: [Zúrich, Suiza](#)

Categorías: [Internacional](#) [Medicina Infantil](#) [Otras ciencias](#) [Bienestar](#)

NotasdePrensa

<https://www.notasdeprensa.es>