

June 4, 2012

MethylGene Presents MGCD265 Data at The 2012 American Society of Clinical Oncology (ASCO) Annual Meeting

Montreal, Canada. June 4, 2012 - MethylGene Inc. (TSX:MYG) today announced that clinical data for its Met/VEGFR multi-kinase inhibitor MGCD265 was presented in a poster session at the 2012 ASCO Annual Meeting held in Chicago, Illinois. The poster, entitled "MGCD265, a multitargeted oral tyrosine kinase receptor inhibitor of Met and VEGFR: Dose-escalation Phase I study" (Abstract #3039) provided an interim update on the monotherapy trial 265-101.

Trial 265-101 is an ongoing Phase I, multicenter, open-label trial. In this trial patients are treated with MGCD265 alone, dosed orally every day over a 21 day cycle. Data was presented on 57 patients with advanced metastatic or unresectable solid malignancies that were refractory to standard therapy and/or unlikely to derive clinical benefit from existing therapies.

In an *ex vivo* system designed to assess the biological activity of MGCD265 using plasma samples from study patients, increased plasma concentration of MGCD265 was associated with inhibition of Met phosphorylation in a dose-dependent manner, suggesting coverage of the biological target, Met, in the clinical setting.

Stable disease was observed in 23 patients (of a total of 57 enrolled). No objective responses were observed to date. MGCD265 continues to be well-tolerated. Adverse events were mostly mild to moderate at all doses tested. The most frequent treatment-related adverse events (all grades) included diarrhea, anorexia, nausea, fatigue and vomiting. Seven (7) treatment-related grade 3 events were reported and of these, 3 were considered dose-limiting: fatigue, pituitary hemorrhage and elevated lipase. All dose limiting events occurred in cycle 1 at daily doses = 250 mg/m².

"The safety profile of MGCD265 continues to be favorable at exposures that show pharmacodynamic and biological effect", said Dr. Rachel Humphrey, Executive Vice President and Chief Medical Officer of MethylGene Inc. "We continue to be excited about the potential for MGCD265, both as a monotherapy and in combination with other anti-cancer agents." Dose escalation continues in trial 265-101 and final data will be presented at a future medical meeting. A series of expansion cohorts is planned when the maximum tolerated dose is determined.

About MGCD265

MGCD265 is a novel, oral small molecule inhibitor that targets a unique spectrum of receptor tyrosine kinases: Met, VEGFR 1, 2, and 3, Tie-2 and Ron. These kinases play key roles in tumor development, survival and metastasis as well as the inappropriate formation of blood vessels (angiogenesis) that nourish the tumor. MGCD265 has completed one Phase 1 single agent study, and is nearing completion of one Phase 1 single agent clinical trial and one Phase 1/2 combination clinical trial (with erlotinib and docetaxel) in solid tumors.

About MethylGene

MethylGene Inc. (TSX:MYG) is a small molecule drug development company that is advancing two novel therapeutics for cancer and infectious disease in human clinical trials. The Company's lead product candidates are: MGCD290, an oral antifungal agent targeting the fungal Hsp90 enzyme that is currently in Phase 2 trials for vulvovaginal candidiasis, and MGCD265, an oral Met/VEGF receptor kinase inhibitor that is in Phase 1/2 clinical trials for solid tumor cancers. MethylGene owns all rights to its lead product candidates, and has partnerships with Otsuka Pharmaceutical Co. Ltd., Taiho Pharmaceutical Co. Ltd., and EnVivo Pharmaceuticals, Inc. for its other pipeline programs. **Montréal, Québec, Canada, le 4 juin 2012** - MethylGene Inc. (TSX:MYG) annonce aujourd'hui que des données cliniques sur le MGCD265, l'inhibiteur de kinases à cibles multiples Met/VEGF-R de la Société, ont été présentées lors d'une session de présentation d'affiche au cours de l'assemblée annuelle 2012 de l'ASCO qui se tient à Chicago, en Illinois. L'affiche, intitulée « MGCD265, un inhibiteur des récepteurs à tyrosine kinase Met et VEGFR à cibles multiples administré par voie orale : étude de phase I à dose croissante » (résumé d'étude n° 3039) a fourni une mise à jour de l'étude n° 265-101 en monothérapie.

L'étude n° 265-101 en cours est une étude de phase I multicentrique et ouverte. Dans cette étude, les patients reçoivent du MGCD265 en monothérapie chaque jour par voie orale, pendant un cycle de 21 jours. Les données présentées ont été recueillies auprès de 57 patients atteints de tumeurs solides métastatiques de stade avancé ou non résécables, qui ont été réfractaires à un traitement standard et/ou peu susceptibles d'obtenir des bénéfices cliniques de traitements existants.

Dans un système *ex vivo* conçu pour évaluer l'activité biologique du MGCD265 au moyen d'échantillons de plasma provenant de participants à l'étude, l'augmentation de la concentration plasmique du MGCD265 a été associée à l'inhibition de la phosphorylation de Met d'une manière liée à la dose, suggérant que la cible biologique Met a été atteinte dans ces conditions cliniques.

Une stabilisation de la maladie a été observée auprès de 23 patients (sur un total de 57 patients recrutés). Aucune réponse objective n'a été observée à ce jour. Le MGCD265 continue à être bien toléré. Les effets indésirables étaient surtout faibles à modérés à toutes les doses administrées. Les effets indésirables liés au traitement les plus fréquents (tous niveaux confondus) ont été la diarrhée, l'anorexie, la fatigue et des vomissements. Sept (7) effets de niveau 3 liés au traitement ont été constatés et trois d'entre eux ont été considérés comme limitatifs de la dose : la fatigue, l'hémorragie pituitaire et un niveau élevé de lipase. Tous les effets limitatifs de la dose sont survenus au cours du premier cycle à des doses quotidiennes = 250 mg/m².

« Le profil d'innocuité du MGCD265 demeure favorable à des niveaux permettant d'obtenir un effet pharmacodynamique et biologique », a déclaré Dr Rachel Humphrey, vice-présidente directrice et chef de la direction médicale de MethylGene Inc. « Le potentiel du MGCD265 nous remplit d'enthousiasme, à la fois en monothérapie et en traitement combiné avec d'autres agents anticancéreux ». L'augmentation de la dose se poursuit dans l'étude n^o 265-101 et des données définitives seront dévoilées lors de réunions scientifiques ultérieures. Une série de cohortes supplémentaires sont planifiées lorsque la dose maximale tolérée sera déterminée.

À propos du MGCD265

Le MGCD265, un inhibiteur innovant de petite taille actif par voie orale, cible un éventail unique de récepteurs à tyrosine kinase : Met, ceux de VEGF 1, 2 et 3, Tie-2 et RON. Ces kinases jouent des rôles clés dans le développement, la survie et l'activité métastatique des tumeurs, ainsi que dans la formation inopportune de vaisseaux sanguins (angiogenèse) qui les nourrissent. Une étude de phase 1 sur le MGCD265 en monothérapie a été achevée et deux autres études sur des tumeurs solides sont presque terminées, soit une étude clinique de phase 1 en monothérapie et une étude clinique de phase 1/2 en traitement combiné (avec de l'erlotinib ou du docetaxel).

À propos de MethylGene

MethylGene Inc. (TSX : MYG), une société qui met au point des médicaments de petite taille, fait progresser en études cliniques chez les humains deux nouveaux traitements qui ciblent le cancer et les maladies infectieuses. Les deux principaux produits candidats de la Société sont : le MGCD290, un agent antifongique par voie orale ciblant l'enzyme fongique Hos2 qui fait actuellement l'objet d'études de phase 2 sur la candidose vulvo-vaginale ; et le MGCD265, un inhibiteur de kinases à récepteurs Met/VEGF par voie orale, en cours d'essais cliniques de phase 1/2 sur des cancers à tumeurs solides. MethylGene détient la totalité des droits associés à ses principaux produits candidats et a signé des partenariats avec Otsuka Pharmaceutical Co. Ltd., Taiho Pharmaceutical Co. Ltd. et EnVivo Pharmaceuticals, Inc. pour les autres programmes de son portefeuille de produits.

Investor Relations Contacts

Mark J. Gergen

Executive Vice President & COO
Mirati Therapeutics, Inc.
Tel.: 858.535.2075

ir@mirati.com

mirati.com

Tracey Rowlands, PhD

Director of Investor Relations and Business Development
Mirati Therapeutics, Inc.
Tel.: 514.337.3333 ext. 512

ir@mirati.com

mirati.com

Michael Wood

Managing Director
LifeSci Advisors
Tel.: 646.597.6983

mwood@lifesciadvisors.com

www.lifesciadvisors.com