



August 2, 2012

## **MethylGene Reports Second Quarter 2012 Financial Results and Provides an Update on its Clinical Programs**

**Montreal, Canada. August 2, 2012** - MethylGene Inc. (TSX: MYG) today reported financial results for the second quarter ended June 30, 2012 and provided an update on its clinical programs.

### **Highlights**

- As of August 1<sup>st</sup>, over one third of the patients have been enrolled in the first Phase II trial of our novel antifungal agent, MGCD290, and we expect to complete enrollment on schedule.
- Dose escalation continues in Phase I (monotherapy and combination) trials of our Met/VEGFR kinase inhibitor for oncology, MGCD265. The safety profile remains favorable.
- Clinical data were presented on June 4<sup>th</sup> regarding MGCD265 at the American Society of Clinical Oncology (ASCO) Annual Meeting, demonstrating that MGCD265 inhibited its biological target, Met, and continued to exhibit a favorable safety profile.
- On June 27<sup>th</sup>, at our Annual General Meeting, the shareholders approved the nomination of Rodney Lappe, Ph.D. to the Board of Directors.
- We finished the quarter with \$22.2 million in cash and cash equivalents.

"We are very pleased with our clinical progress this past quarter," said Charles Grubsztajn, President and CEO of MethylGene. "Our Phase II trial for MGCD290 is enrolling at a robust rate, and we remain on track to report top line data from this trial around year end. We continue to enroll patients in our MGCD265 trials, with excellent tolerability at relevant drug exposure levels where we are seeing strong inhibition of the Met target."

### **MGCD290 Clinical Development Update**

Recruitment is ongoing in our first Phase II trial of MGCD290. This trial is focused on patients with moderate to severe acute vulvovaginal candidiasis (VVC), a form of yeast infection for which there is only limited response from standard treatments.

This randomized, multicenter, double-blind and placebo-controlled trial is evaluating the effectiveness of MGCD290 in combination with fluconazole, as compared to fluconazole alone. The primary endpoint for this trial is the Therapeutic Cure at day 28, which is a composite endpoint of Clinical Cure (resolution of signs and symptoms of the infection) and Mycological Cure (an absence of yeast in culture). We expect to enroll approximately 180 patients to get 150 evaluable patients for the primary endpoint. Nineteen sites in the United States are now open for enrolment, and as of August 1, 2012 74 patients have been enrolled in the trial. Based on the current rate of enrollment, we continue to expect top line data from this trial around the end of 2012.

As recurrent VVC patients are now eligible for enrollment in our VVC trial following a protocol amendment, the Company has decided not to proceed with a separate recurrent VVC trial at this time. Preparations for another Phase II trial with MGCD290 are ongoing.

MGCD290 is a first-in-class orally available, small molecule inhibitor of the fungal enzyme, Hos2, an enzyme that regulates fungal genes. *In vitro*, MGCD290 in combination with fluconazole reverses fluconazole resistance (primary and acquired) in a wide range of fungal species, including *Candida glabrata*. In Phase I clinical trials the safety profile of MGCD290 (monotherapy and in combination with fluconazole) was favorable, with no liver or cardiovascular serious adverse events (SAEs). MGCD290 is initially being developed for use in combination with fluconazole, the most widely prescribed antifungal drug, for the treatment of fungal infections.

Data from the MGCD290 program will be presented at upcoming scientific meetings including the 52<sup>nd</sup> Annual Interscience Conference on Antimicrobial Agents and Chemotherapy (ICAAC) in September 2012 and IDWeek (a Joint Meeting of IDSA, SHEA, HIVMA, and PIDS) in October 2012.

### **MGCD265 Clinical Development Update**

MGCD265 is a rationally designed, orally available Met/VEGF receptor kinase inhibitor in development for oncology indications. At the ASCO Annual Meeting in June, we presented data using plasma samples from trial patients demonstrating a dose-response relationship between increased plasma concentration of MGCD265 and inhibition of Met phosphorylation in a novel *ex vivo* assay system. MGCD265 continues to be well tolerated in both monotherapy and in combination trials.

In the monotherapy trials, grade 3-4 treatment-related adverse events have been infrequent and long-term stable disease has been observed in sarcomatoid bladder, papillary renal, neuroendocrine, thymic and colon cancer. In the docetaxel arm of the combination trial, objective responses have been observed in non-small cell lung cancer (NSCLC), prostate cancer and endometrial cancer. Of ten evaluable NSCLC patients in this trial, two achieved partial remission and all ten patients achieved disease control (partial remission or stable disease) at the first tumor assessment. These data compare favorably in the context of historical data (docetaxel monotherapy). In the erlotinib arm of the combination trial, prolonged stable disease has been observed in gastric, esophageal, NSCLC and chordoma. MGCD265 has been well tolerated in combination with either full dose docetaxel or erlotinib.

Enrollment of patients continues in the MGCD265 monotherapy and combination trials. The development plan for MGCD265 includes expansion cohorts in select tumor types once the recommended Phase II dose is defined and data from the expansion cohorts will be used to guide randomized Phase II trials.

Data from the MGCD265 program will be presented at upcoming medical meetings including the European Society for Medical Oncology (ESMO) Congress in September 2012.

## Second Quarter 2012 Financial Results Reported in Canadian Dollars

[Click here](#) to view the Q2 press release with financial statements.

The Company's financial statements for the period ended June 30, 2012 have been prepared in accordance with IAS 34, Interim Financial Reporting, as issued by the International Accounting Standards Board (IASB).

The Company reported no revenues in the second quarter ended June 30, 2012, versus \$1.3 million for the second quarter of 2011. The decline in revenues was due to the completion of the research component of the agreement with Otsuka Pharmaceutical Co. Ltd. in June of 2011, and we had recognized all remaining deferred revenues under the Otsuka and Taiho Pharmaceutical Co. Ltd. agreements in 2011.

Research and development expenditures, net of investment tax credits, for the second quarter of 2012 were \$3.7 million versus \$1.8 million in the second quarter of 2011. This increase was primarily due to increased clinical development activity for both the MGCD290 and MGCD265 programs.

General and administrative expenses in the second quarter of 2012 were \$1.1 million, no change versus the second quarter of 2011.

Financial income of \$59,000, relating primarily to interest income, in the second quarter of 2012 was \$25,000 lower compared to the second quarter of 2011 due to lower cash balances in the second quarter of 2012 versus the prior year. The Company recorded a foreign exchange gain of \$11,000 in the second quarter of 2012 compared to a gain of \$27,000 in the second quarter of 2011.

The net loss and comprehensive loss for the second quarter ended June 30, 2012 was \$4.7 million, or (\$0.01) per share, compared to a net loss and comprehensive loss of \$1.5 million, or (\$0.005) per share, for the same period last year. The increased loss per share relates to the higher net loss and comprehensive loss for the quarter.

Cash, cash equivalents, marketable securities and restricted cash totaled \$22.2 million as at June 30, 2012 compared to \$29.6 million on December 31, 2011. The Company believes it has sufficient financial resources to carry forward its current clinical development and operating plans into the fourth quarter of 2013.

## 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 Hos2 enzyme that is currently in Phase II trials for vulvovaginal candidiasis, and MGCD265, an oral Met/VEGF receptor kinase inhibitor that is in Phase I/II 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 2 août 2012**

- MethylGene Inc. (TSX : MYG) présente aujourd'hui ses résultats financiers du deuxième trimestre terminé le 30 juin 2012 et fournit une mise à jour de ses programmes cliniques.

## Faits saillants

- Au 1<sup>er</sup> août 2012, plus du tiers des patients ont été recrutés dans le cadre de la première étude de phase II menée sur le MGCD290, notre agent antifongique innovant, et nous nous attendons à ce que le recrutement soit terminé dans les délais prévus.
- L'augmentation de la dose se poursuit dans les études de phase I menées sur le MGCD265, notre inhibiteur de récepteurs kinase Met/VEGFR ciblant le cancer. Le profil d'innocuité est toujours favorable.
- Les données cliniques relatives au MGCD265 présentées le 4 juin dernier lors de l'assemblée annuelle de l'American Society of Clinical Oncology (ASCO) démontrent que le MGCD265 a inhibé Met, sa cible biologique, et a continué à présenter un profil d'innocuité favorable.
- Le 27 juin dernier, lors de notre assemblée annuelle, les actionnaires ont approuvé la nomination de Rodney Lappe, Ph.D. au conseil d'administration.
- Notre trésorerie et nos équivalents de trésorerie s'élèvent à 22,2 millions \$ à la fin du trimestre.

« Nous sommes très satisfaits des progrès cliniques accomplis au cours du trimestre qui vient de s'achever », a déclaré Charles Grubszajn, président et chef de la direction de MethylGene. « Comme le recrutement pour notre étude de phase II menée sur le MGCD290 se poursuit à bon rythme, nous continuons d'envisager une présentation des grandes lignes des résultats vers la fin de l'année. Le recrutement de patients se poursuit pour nos études menées sur le MGCD265, lequel présente une excellente tolérabilité à des niveaux significatifs d'exposition au médicament, auxquels nous observons une forte inhibition de la cible Met ».

### Mise à jour du développement clinique du MGCD290

Le recrutement pour notre première étude de phase II menée sur le MGCD290 est en cours. Cette étude cible des patientes atteintes de candidose vulvo-vaginale (CVV) aiguë modérée à sévère, un type d'infection à levure pour lequel l'efficacité des traitements standards demeure limitée.

Cette étude aléatoire, comparative contre placebo, en double aveugle et multicentrique, vise à évaluer l'efficacité du MGCD290 utilisé en traitement combiné avec du fluconazole, comparativement au fluconazole pris seul. Le principal critère d'évaluation de cette étude est l'atteinte de la « cure thérapeutique » au 28<sup>e</sup> jour, un critère combiné constitué des critères primaires d'évaluation du traitement clinique (élimination des signes et symptômes associés à l'infection) et du traitement mycologique (absence de levures en culture). Nous prévoyons recruter environ 180 patientes afin d'en obtenir 150 qui soient évaluables selon le principal critère d'évaluation. Dix-neuf sites américains recrutent actuellement des patientes et, en date du 1<sup>er</sup> août 2012, 74 patientes ont été recrutées pour participer à cette étude. En nous basant sur le rythme de recrutement actuel, nous prévoyons que les données brutes provenant de cette étude seront disponibles d'ici la fin de 2012.

Puisque les patientes atteintes de CVV récurrente sont maintenant admissibles à notre étude sur la CVV à la suite d'un amendement au protocole, la Société a décidé de ne pas procéder à une étude distincte sur la CVV récurrente pour le moment. Les préparatifs en vue d'une autre étude de phase II sur le MGCD290 sont en cours.

Le MGCD290, un inhibiteur à molécules de petite taille actif par voie orale, est le premier de sa classe à cibler l'enzyme fongique Hos2, une enzyme qui régule les gènes fongiques. *In vitro*, le MGCD290 combiné à du fluconazole inverse la résistance au fluconazole (naturelle et acquise) dans une vaste gamme d'espèces fongiques, dont *Candida glabrata*. Lors d'études cliniques de phase I, le MGCD290 (utilisé en monothérapie et en traitement combiné avec du fluconazole) a présenté un profil d'innocuité favorable, aucun incident thérapeutique grave (ITG) cardiovasculaire ou hépatique n'ayant été constaté. Le MGCD290 est primordialement développé en vue d'une utilisation conjointe avec du fluconazole, le médicament antifongique le plus largement prescrit, afin de traiter les infections fongiques.

Des données issues du programme sur le MGCD290 seront présentées lors de prochains congrès scientifiques, notamment la 52<sup>e</sup> rencontre annuelle de l'Interscience Conference on Antimicrobial Agents and Chemotherapy (ICAAC), qui se tiendra en septembre 2012, et la conférence IDWeek (conjointement organisée par les associations médicales américaines suivantes : IDSA, SHEA, HIVMA et PIDS), qui aura lieu en octobre 2012.

### Mise à jour du développement clinique du MGCD265

Le MGCD265 est un inhibiteur des récepteurs kinase Met/VEGFR conçu de façon rationnelle et actif par voie orale, développé pour des indications oncologiques. Lors de l'assemblée annuelle de l'ASCO qui s'est tenue en juin dernier, nous avons présenté des données provenant d'échantillons de plasma de participants de l'étude qui démontrent une relation dose-effet entre l'augmentation de la concentration de MGCD265 plasmatique et la phosphorylation de Met, en utilisant un système

innovant de tests *ex vivo*. Le MGCD265 continue d'être bien toléré lors des études cliniques en monothérapie et en traitement combiné.

Lors des études en monothérapie, des incidents thérapeutiques de grade 3 ou 4 liés au traitement ont été peu fréquents et une stabilisation de la maladie à long terme a été observée chez des patients atteints des cancers suivants : carcinome sarcomatoïde de la vessie, carcinome papillaire rénal, carcinome neuroendocrinien, cancer du thymus et cancer du côlon. Dans le sous-groupe recevant du docetaxel de l'étude en traitement combiné, des réponses objectives ont été observées chez des patients atteints de cancer du poumon non à petites cellules (CPNPC), de cancer de la prostate et de cancer de l'endomètre. Dans cette étude, lors de la première évaluation tumorale des dix patients évaluables atteints de CPNPC, une rémission partielle a été constatée chez deux d'entre eux et un contrôle de la maladie (une rémission partielle ou une stabilisation de la maladie) a été observé chez les dix patients. Ces données se comparent favorablement aux données historiques recueillies lors d'études sur le docetaxel en monothérapie. Dans le sous-groupe recevant de l'erlotinib en traitement combiné, une stabilisation prolongée de la maladie a été observée chez des patients atteints des cancers suivants : cancer de l'estomac, cancer de l'œsophage, CPNPC et chordomes. Le MGCD265 a été bien toléré lorsque administré avec une dose complète de docetaxel ou d'erlotinib.

Le recrutement de patients se poursuit pour les études menées sur le MGCD265 en monothérapie et en traitement combiné. Le plan de développement du MGCD265 prévoit l'élargissement des cohortes des types de tumeurs sélectionnés, une fois déterminée la dose recommandée pour la phase II. Les données issues de ces cohortes élargies serviront à la préparation des études aléatoires de phase II.

Des données issues du programme sur le MGCD265 seront présentées lors de prochaines rencontres scientifiques, notamment au congrès de la Société européenne de médecine interne cancérologique (ESMO), qui se tiendra en septembre 2012.

## Résultats financiers du deuxième trimestre de 2012, présentés en dollars canadiens

[Cliquez ici](#) pour consulter le présent communiqué avec les états financiers du 2<sup>ème</sup> trimestre.

Les états financiers de la Société pour la période terminée le 30 juin 2012 ont été préparés en conformité avec la norme IAS 34 sur l'information financière intermédiaire, telle que publiée par l'*International Accounting Standards Board* (IASB).

La Société n'a généré aucun produit durant le deuxième trimestre terminé le 30 juin 2012, comparativement à des produits de 1,3 million \$ au deuxième trimestre de 2011. Cette diminution des produits s'explique par le fait que la portion « recherche » de l'entente avec Otsuka Pharmaceutical Co. Ltd s'est terminée en juin 2011 et par l'amortissement complet en 2011 des produits reportés restants selon les ententes conclues avec Otsuka et Taiho Pharmaceutical Co. Ltd.

Au deuxième trimestre de 2012, les frais de recherche et de développement, nets des crédits d'impôt à l'investissement, ont totalisé 3,7 millions \$, comparativement à 1,8 million \$ au deuxième trimestre de 2011. Cette hausse est principalement due à l'accroissement des activités liées au développement clinique de nos programmes sur le MGCD290 et le MGCD265.

Les charges générales et administratives du deuxième trimestre de 2012 se sont élevées à 1,1 million \$, et sont demeurées inchangées comparativement au deuxième trimestre de 2011.

Les revenus financiers du deuxième trimestre de 2012, principalement constitués d'intérêts créditeurs, se sont élevés à 59 000 \$, soit 25 000 \$ de moins qu'au deuxième trimestre de 2011, en raison d'une trésorerie détenue moins élevée au deuxième trimestre de 2012 comparativement à l'année précédente. La Société a enregistré un profit de change de 11 000 \$ durant le deuxième trimestre de 2012, comparativement à un profit de 27 000 \$ au deuxième trimestre de 2011.

La perte nette et le résultat étendu du deuxième trimestre terminé le 30 juin 2012 se sont élevés à 4,7 millions \$ ou (0,01 \$) par action, comparativement à une perte nette et un résultat étendu de 1,5 million \$ ou (0,005 \$) par action lors de la période correspondante de l'année précédente. La perte par action plus importante s'explique par une perte nette et un résultat étendu plus élevés au cours du trimestre.

Au 30 juin 2012, la Société disposait de 22,2 millions \$ en trésorerie, équivalents de trésorerie, titres négociables et liquidités soumises à restriction, comparativement à 29,6 millions \$ au 31 décembre 2011. La Société estime qu'elle dispose de ressources financières suffisantes pour faire progresser ses plans de développement clinique et d'exploitation actuels jusqu'aux derniers mois de 2013.

## 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 l'humain 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 actif par voie orale ciblant l'enzyme fongique Hos2 qui fait actuellement l'objet d'études de phase II sur la candidose vulvo-vaginale ; et le MGCD265, un inhibiteur de récepteurs kinases Met/VEGF actif par voie orale, en cours d'essais cliniques de phase I/II 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](mailto:ir@mirati.com)

[mirati.com](http://mirati.com)

### **Tracey Rowlands, PhD**

Director of Investor Relations and Business Development

Mirati Therapeutics, Inc.

Tel.: 514.337.3333 ext. 512

[ir@mirati.com](mailto:ir@mirati.com)

[mirati.com](http://mirati.com)

### **Michael Wood**

Managing Director

LifeSci Advisors

Tel.: 646.597.6983

[mwood@lifesciadvisors.com](mailto:mwood@lifesciadvisors.com)

[www.lifesciadvisors.com](http://www.lifesciadvisors.com)