サノフィ株式会社

ランタス XR 注ソロスター

CTD 第二部 ー 非臨床概要

2.6.1 緒言

Total number of pages: 5

目　　次

1　　緒言 **4**

図　目　次

図 1 - インスリン グラルギンの構造式 4

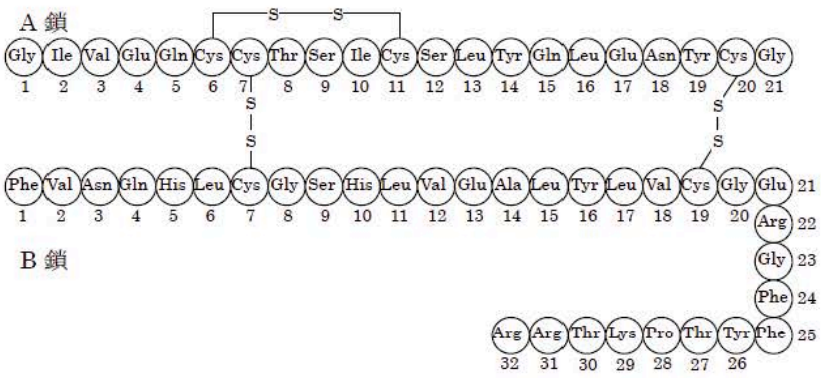
1　緒言

HOE901-U300 は、遺伝子組換えによる持効型溶解インスリンアナログ製剤であり、1 mL あたり 300 単位のインスリン グラルギンを含有する注射剤である。

インスリン グラルギンは、遺伝子組換えにより、ヒトインスリンの B 鎖 30 位に 2 つのアルギニン残基を付加し、A 鎖 21 位のアミノ酸をアスパラギンからグリシンに置換したインスリンアナログであり、化学名は 21^{A}-glycine-30^{B}a-L-arginine-30^{B}b-L-arginine-human insulin である。（図 1 ）。

図 1 - インスリン グラルギンの構造式

構造式：



分子式：　$C_{267}H_{404}N_{72}O_{78}S_6$

相対分子量：　6063

既知化合物との構造的類似性：インスリン グラルギンはヒトインスリンとの構造的類似性を示す

インスリン グラルギンの持効性は、組織 pH での溶解度が低いことに起因する。インスリン グラルギンは、酸性の注射液中では完全に溶解しているが、皮下投与すると、無晶性の等電点沈殿物を形成し、ここから微量ずつ持続的に放出される。

HOE901-U300 は、現在市販されているインスリン グラルギン 100 単位/mL（ランタス）と同様の組成を持ち、有効成分であるインスリン グラルギンの分量を 3 倍にし、それに伴って注射剤中の[redacted]にした製剤である。

本申請において予定している「効能又は効果」及び「用法及び用量」を以下に示す。

効能又は効果

インスリン療法が適応となる糖尿病

用法及び用量

通常、成人では、初期は 1 日 1 回 4～20 単位を皮下注射するが、ときに他のインスリン製剤を併用することがある。注射時刻は毎日一定とする。投与量は、患者の症状及び検査所見に応じて増減する。なお、その他のインスリン製剤投与量を含めた維持量は、通常 1 日 4～80 単位である。ただし、必要により上記用量を超えて使用することがある。