メタコリン塩化物

プロボコリン吸入粉末溶解用 100 mg

ケンブラン吸入粉末溶解用 100 mg

第 2 部（モジュール 2）

2.2.　緒言

株式会社三和化学研究所

参天製薬株式会社

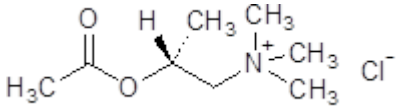
目次

2.2. 諸言 ····· 3
2.2.1. 緒言 ····· 3
2.2.2. 参考文献 ····· 4

2.2. 諸言

2.2.1. 緒言

メタコリン塩化物（以下，メタコリン）は，アセチルコリンのβ-メチル同族体であり（図2.2.1-1），副交感神経作動性（コリン作動性）の薬剤である。



及び鏡像異性体

図 2.2.1-1 メタコリン塩化物の化学構造式

メタコリンは1911年にTaveau及びHuntにより創製されたとされ[1]，当初は精神科領域やその他領域において自律神経機能を評価する検査（Funkenstein test，メコリール試験）に用いられた[2][3]が，その後は主に気道過敏性検査に用いられている。気道過敏性検査は気管支喘息患者が健康被験者と比べて吸入したメタコリンに対する感受性が高いことを利用して気管支喘息の診断を行う検査である。

メタコリンは当初は国内外で承認された医療用医薬品がなかったため，研究用試薬を用いて検査が行われていたのが実情であった。1986年にHoffmann- La Roche Inc.はアメリカにおいて本剤（現商品名 Provocholine®）の承認を取得し発売した。その後，Hoffmann- La Roche Inc.は本剤に関する権利をMethapharm Inc.に承継するとともに，Methapharm社は1999年にカナダにおいても承認を取得し，販売している。さらに，欧州（スペイン）等でもMethapharm Inc.あるいはライセンスを受けた会社が承認を取得し販売している。

国内では，依然として数社から販売されている研究用試薬を用いて検査が行われているのが実情であるため，メタコリンが医療現場で医療用医薬品として医療保険適用下で適正に使用されることが望まれている。本剤は「医療上の必要性の高い未承認薬・適応外薬検討会議」において医療上の必要性が高い未承認薬と判断され，2012年に開発会社が公募された。

株式会社三和化学研究所及び参天製薬株式会社はこの開発会社の公募に対して応募し，開発を行った。その結果，現在までに得られた品質，非臨床試験，臨床試験成績及び参考とした文献等から，本剤の有効性及び安全性が確認されたと判断し，以下の内容で承認申請を行うこととした。

効能・効果及び用法・用量（案）

効能・効果	気道過敏性検査
用法・用量	メタコリン塩化物100 mg（1バイアル）に日局生理食塩液を加え溶解及び希釈し，通常0.039～25 mg/mLの範囲の適切な希釈系列の希釈液を調製する。成人及び小児ともに，調製した希釈系列の低濃度よりネブライザーを用いて吸入し，気道過敏性検査を実施する。

2.2.2. 参考文献

[1] Brown JH, Taylor P. Muscarinic receptor agonists and antagonists. In: Hardman JG, ed. Goodman & Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 9th ed. 1996:141-160.

[2] Rouleau Y, Coulombe M. Clinical applications of the Funkenstein test to psychiatric patients. Can Med Assoc. J. 1957; 77: 116-121.

[3] 笠井和, 阿部栄子, 伊村和子. 小児におけるメコリール試験. 東京女子医科大学雑誌. 1961; 31: 348-353