メサラジン
リアルダ錠 1200mg

第 2 部（モジュール 2）
CTD の概要（サマリー）

2.6 非臨床試験の概要文及び概要表

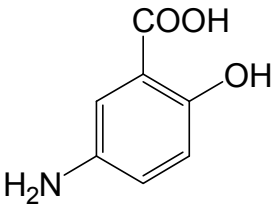
2.6.1 緒言

持田製薬株式会社

2.6.1 緒言

潰瘍性大腸炎の治療薬の一つとしてメサラジン（化学構造式を図 2.6.1- 1 に示す）製剤が使用されている。メサラジンは消化管粘膜局所に浸透して抗炎症作用を発揮することが知られている[1),2)]。メサラジンの副作用発現リスクは全身曝露量に依存するものと考えられ、経口投与後速やかに小腸上部で吸収される[3)]ことから、メサラジンの放出調整に様々な製剤学的工夫が施された経口メサラジン製剤が海外および本邦で臨床使用されている。

図 2.6.1- 1 メサラジンの構造式



MD-0901 は、イタリアの Cosmo 社および英国の Shire 社によって開発されたメサラジンの経口 DDS（Drug delivery system）製剤である。MD-0901 は 1 日 1 回投与の経口メサラジン製剤であり、長期間の薬剤投与を必要とする潰瘍性大腸炎患者の治療、ならびに服薬コンプライアンスおよび QOL（Quality of life）の向上に貢献すると考えられたことから、持田製薬株式会社は 2009 年 1 月に Shire 社から本邦における開発・販売権を取得し、開発に着手することとした。

メサラジンの薬理試験、薬物動態試験および毒性試験に関しては、既承認のメサラジン製剤であるペンタサ®錠およびアサコール®錠の承認申請時に評価されており、また、メサラジンに関する論文および資料が国内外で数多く公表されていることから、MD-0901 の申請では、非臨床試験の評価にこれらの公表論文および公表資料を用いた。

MD-0901 の国内で予定される効能・効果および用量・用法を表 2.6.1- 1 に示した。

表 2.6.1- 1 MD-0901 の効能・効果および用量・用法（案）

効能・効果	潰瘍性大腸炎（重症を除く）
用量・用法	通常、成人にはメサラジンとして 1 日 1 回 2,400 mg を食後経口投与する。活動期は、通常、成人にはメサラジンとして 1 日 1 回 4,800 mg を食後経口投与するが、患者の状態により適宜減量する。

参考文献一覧

1）日比紀文, 高田康裕, 長沼誠. DDS を用いた炎症性腸疾患の治療. 炎症と免疫. 2007; 15: 230-5. ＜資料番号 4.3.2-1＞

2）矢島知治. 潰瘍性大腸炎の内科的治療. 診断と治療. 2008; 96: 2484-90. ＜資料番号 4.3.2-2＞

3）Haagen Nielsen O, Bondesen S. Kinetics of 5-aminosalicylic acid after jejunal instillation in man. Br J Clin Pharmacol. 1983; 16: 738-40. ＜資料番号 4.3.2-3＞