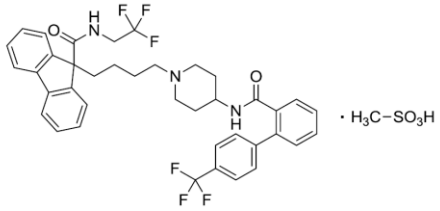
1.10 毒薬・劇薬等の指定審査資料のまとめ

化学名・別名	ロミタピドメシル酸塩
構造式	
効能・効果	ホモ接合体家族性高コレステロール血症
用法・用量	通常、成人には、1 日 1 回夕食後 2 時間以上あけて、ロミタピドとして 5 mg の経口投与から開始する。忍容性に問題がなく、効果不十分な場合には 2 週間以上の間隔をあけて 10 mg に増量する。さらに増量が必要な場合には、4 週間以上の間隔で忍容性を確認しながら段階的に 20 mg、40 mg に増量することができる。
劇薬等の指定	
市販名及び有効成分・分量	原体：ロミタピドメシル酸塩 製剤：ジャクスタピッドカプセル 5mg （1 カプセル中にロミタピドメシル酸塩 5.69mg（ロミタピドとして 5mg に相当）を含有） ジャクスタピッドカプセル 10mg （1 カプセル中にロミタピドメシル酸塩 11.39mg（ロミタピドとして 10mg に相当）を含有） ジャクスタピッドカプセル 20mg （1 カプセル中にロミタピドメシル酸塩 22.77mg（ロミタピドとして 20mg に相当）を含有）

毒性

急性

動物種	性別	投与経路	最大非致死量 (mg/kg)	概算致死量 (mg/kg)
マウス	♂ ♀	経口	1,200	2,400
ラット	♂ ♀	経口	600	1,200

亜急性

動物種	性別	投与期間	投与経路	投与量 (mg/kg/day)	無毒性量 (mg/kg/day)	主な所見
ラット	♂ ♀	1ヵ月	経口	0.5, 5, 50	0.5	0.5mg/kg/day 及び 5mg/kg/day 投与で血清トリグリセリド値及びコレステロール値の低下と相関する肝臓及び小腸での可逆的な脂質蓄積。5mg/kg/day 投与で、ALP 上昇。50mg/kg/day 投与でビタミン K 欠乏と考えられる大量出血による死亡。
イヌ	♂ ♀	1ヵ月	経口	0.02, 0.2, 2, 20	0.02	0.2mg/kg/day 以上の投与で、投与依存的な血清コレステロール及びトリグリセリド減少、肝臓及び小腸での脂質蓄積。2mg/kg/day 以上の投与で、体重、摂餌量、血圧、心拍数の減少、軽度～著明な血清 ALT 及び AST 上昇と、軽微な肝細胞壊死。

慢性

動物種	性別	投与期間	投与経路	投与量 (mg/kg/day)	無毒性量 (mg/kg/day)	主な所見
ラット	♂ ♀	6ヵ月	経口	0.02, 0.2, 2, 20	0.02	死亡などの明らかな毒性は 20mg/kg/day 投与のビタミン非補給ラットで発現した。全投与では血清トリグリセリド及びコレステロール値の減少と関連する肝臓及び小腸で脂質蓄積。0.2mg/kg/day 以上の投与で、肝臓で亜急性炎症と肝細胞の単細胞壊死、及び肺胞組織球症。2mg/kg/day 及び 20 mg/kg/day 投与で、ALP 上昇。ビタミン K 補給により 20mg/kg/day 投与での出血が抑制された。

	イヌ	♂♀	6ヵ月	経口	0.01, 0.1, 1, 10	0.1	0.01mg/kg/day 以上の投与で、血清トリグリセリド及びコレステロール値の低下と相関する小腸及び肝臓での脂質蓄積。1mg/kg/day 以上の投与で、体重、血圧、心拍数及び赤血球パラメーター減少。10mg/kg/day 投与で、軽度から中程度の ALT 及び AST 上昇、軽度から中程度の精細管変性。
	イヌ	♂♀	12 ヵ月	経口	0.05, 0.5, 5	<0.05	全投与で認められた軟便、明瞭な眼脂、赤血球形態変化、及び投与依存的な血清コレステロール減少。0.5mg/kg/day 及び 5mg/kg/day 投与で、小腸での投与依存的な脂質蓄積。5 mg/kg/day で、体重及び血清トリグリセリドの減少。

副作用

（国内臨床試験（9 例））

本剤投与症例 9 例中 9 例（100.0%）で副作用が報告された。（国内臨床試験 56 週終了時）

副作用	副作用の件数（発現率（%））	副作用	副作用の件数（発現率（%））
胃腸障害	**9 (100.0)**	**代謝及び栄養障害**	**1 (11.1)**
腹部膨満	1 (11.1)	食欲減退	1 (11.1)
下腹部痛	1 (11.1)	**筋骨格系及び結合組織障害**	**1 (11.1)**
下痢	8 (88.9)	筋肉痛	1 (11.1)
軟便	1 (11.1)	**神経系障害**	**1 (11.1)**
放屁	1 (11.1)	頭痛	1 (11.1)
悪心	1 (11.1)	**皮膚及び皮下組織障害**	**2 (22.2)**
一般・全身障害及び投与部位の状態	**1 (11.1)**	薬疹	1 (11.1)
倦怠感	1 (11.1)	湿疹	1 (11.1)
肝胆道系障害	**1 (11.1)**	アレルギー性そう痒症	1 (11.1)
肝機能異常	1 (11.1)	発疹	1 (11.1)
臨床検査	**3 (33.3)**	**血液及びリンパ系障害**	**1 (11.1)**
肝機能検査値異常	3 (33.3)	鉄欠乏性貧血	1 (11.1)

会社

AEGERION PHARMACEUTICALS 株式会社　製剤輸入・製造販売