

目次

図目次 .....	1
略号一覧 .....	2
1. 緒言 .....	3

図目次

図 1-1 ロミタピドメシル酸塩の化学構造 .....	3
-----------------------------	---

## 略号一覧

略称・略号	省略していない表現又は定義	
apo B	Apolipoprotein B	アポリポたん白 B
HoFH	Homozygous familial hypercholesterolemia	ホモ接合体家族性高コレステロール血症
LDL	Low density lipoprotein	低密度リポたん白
LDL-C	LDL cholesterol	低密度リポたん白コレステロール
MTP	Microsomal triglyceride transfer protein	ミクロソームトリグリセリド転送たん白

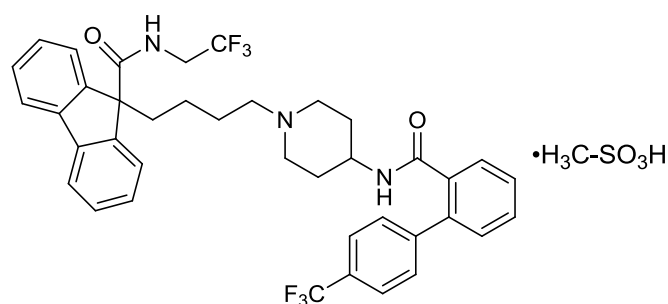
## 1. 緒言

ロミタピドは、ホモ接合体家族性高コレステロール血症（HoFH）患者の低密度リポたん白コレステロール（LDL-C）を低下させる目的で、食事療法及び他の脂質低下治療の補助療法として投与される低分子ミクロソームトリグリセリド転送たん白（MTP）阻害剤である。臨床ではメシル酸塩として使用される。ロミタピドを特定する社内名称として、AEGR-733、■■■■-201038-04（ロミタピドメシル酸塩）、■■■■-201038-01（ロミタピド遊離塩基）がある。活性部分を一般的に示すためにコード名■■■■-201038をAEGR-733と同様に用いることがある。

ロミタピドメシル酸塩の化学名は、N-(2,2,2-trifluoroethyl)-9-[4-[4-[[[4'-(trifluoromethyl)[1,1'-biphenyl]-2-yl]carbonyl]amino]-1-piperidinyl]butyl]-9H-fluorene-9-carboxamide, methane sulfonate salt である。

ロミタピドメシル酸塩の化学構造を図1-1に示した。

図1-1 ロミタピドメシル酸塩の化学構造



ロミタピドはMTPを介するトリグリセリド転送活性及びアポリポたん白B（apo B）含有リポたん白分泌の強力な阻害剤であることが *in vitro* 試験によって示された。ロミタピドはラット、ハムスター及びサルにおいて非常に強力な脂質低下作用を示しており、*in vitro* 作用は *in vivo* においても発揮された。MTP阻害及びそれに続く血漿脂質低下の結果、肝臓及び小腸への中性脂肪の可逆的な蓄積が生じた。このように、MTP阻害、血漿脂質低下並びに肝臓及び小腸の中性脂肪蓄積といった一連の作用は、ロミタピドの最も重要な薬力学作用を反映している。

ロミタピドはHoFH患者における食事療法及びその他の脂質低下治療（例えば経口脂質低下薬治療及びLDLアフェレーシス療法）の補助療法としての長期使用を企図している。

ロミタピドの推奨用量範囲は1日1回5 mgから60 mgである。推奨投与開始用量は1日1回5 mg、最短2週間の経口投与である。用量は最短4週間の間隔で1日1回10 mg、

20 mg、40 mg、最大 60 mg まで増量することができる。本用量漸増法は、個別の患者ごとに有効性を最大にし、かつ胃腸管系の副作用及びトランスアミナーゼ上昇を最小限に抑える至適用量を設定するために設計された。