クレセンバカプセル 100mg
クレセンバ点滴静注用 200mg

イサブコナゾニウム硫酸塩

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

旭化成ファーマ株式会社

目次

1. 緒言 3
1.1 イサブコナゾニウム、イサブコナゾールおよびBAL8728の構造 3
1.2 薬理学的特性 3
2. 申請された臨床適応および用法・用量に関する情報 3
2.1 効能・効果 3
2.2 用法・用量 4

1. 緒言

1.1 イサブコナゾニウム、イサブコナゾールおよび BAL8728 の構造

イサブコナゾニウム硫酸塩は、F. Hoffmann-La Roche, Ltd により創製され、海外では Basilea Pharmaceutica International Ltd.および Astellas Pharma Inc.により開発されたアゾール系抗真菌薬である。イサブコナゾニウム硫酸塩はプロドラッグであり、静脈内投与の場合は血漿エステラーゼ、経口投与の場合は消化管における加水分解により、それぞれ活性本体であるイサブコナゾールおよび不活性分解生成物 BAL8728 に速やかに変換される。各化合物の構造式を図 1-1 に示す。

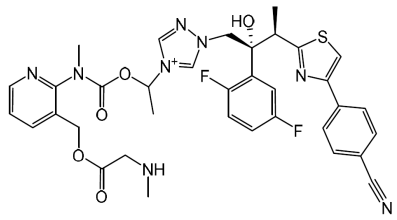
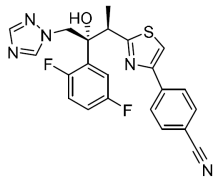
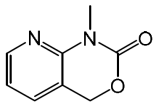
イサブコナゾニウム	
イサブコナゾール	
BAL8728	

図 1-1 構造式

1.2 薬理学的特性

イサブコナゾールは、真菌のエルゴステロール生合成に不可欠なチトクローム P450 依存性ラノステロール-14α-脱メチル化酵素（*CYP51* 遺伝子にコードされる膜内在性タンパク質）に結合し、これを阻害することにより、エルゴステロール産生を阻害する。その結果、真菌膜のエルゴステロールを枯渇させることで真菌膜の構造と機能を破壊し、真菌の増殖を阻害する。

2. 申請された臨床適応および用法・用量に関する情報

2.1 効能・効果

下記の真菌症の治療

- アスペルギルス症（侵襲性アスペルギルス症、慢性進行性肺アスペルギルス症、単純性肺アスペルギローマ）
- ムーコル症
- クリプトコックス症（肺クリプトコックス症、播種性クリプトコックス症、クリプトコックス脳髄膜炎）

2.2 用法・用量

- カプセル剤
  通常、成人にはイサブコナゾールとして 1 回 200 mg を約 8 時間おきに 6 回（負荷投与 48 時間）、負荷投与終了 12～24 時間後より 1 日 1 回経口投与する。

- 静注用剤
  通常、成人にはイサブコナゾールとして 1 回 200 mg を約 8 時間おきに 6 回（負荷投与 48 時間）、負荷投与終了 12～24 時間後より 1 日 1 回、1 時間以上かけて点滴静注する。