

## IV. 薬効薬理・体内動態・同効薬比較のポイントは？

## a. 薬効薬理のポイントは？

## ★ 疾患は？

- 気道の好酸球性炎症は IL-5 等のサイトカインにより亢進し、気管支喘息の病態において中心的な役割を果たす。実際、気管支喘息患者において痰中及び血中の好酸球数が増加している。

## ★ メカニズムは？

- メポリズマブは IL-5 に結合し、好酸球膜上にある IL-5 受容体への結合を阻害する。その結果、好酸球の増殖・分化・活性化が抑制される。

② 薬効薬理の特徴は？ を参照 (p. 20)

## b. 体内動態のポイントは？

## ★ 消失（代謝・排泄）は？

- 腎排泄は受けない。  
 標準的なタンパク分解過程によって分解される全身消失型の薬物である。  
 消失は穏やかであり、蓄積性が認められる。

## ★ 吸収は？

- Tmax は約 5 日であり、皮下から血中への吸収は穏やかである。

## ★ 分布は？

- ヒト血漿でのタンパク結合率は不明である。  
 分布容積は 5.65 L と小さい。

## ★ バイオアベイラビリティは？ 初回通過効果は？ 線形性は？

- 皮下投与時の絶対バイオアベイラビリティは 75% 程度である。  
 単回静脈内投与した時の Cmax、AUC はともに用量依存的に増大し、いずれも投与量に対する線形性を示した。

## ★ P-糖タンパク質などのトランスポーターの関与は？

- 該当資料なし。

③ 体内動態の特徴は？ を参照 (p. 24)

## c. 同効薬比較のポイントは？

- メポリズマブはヒト抗 IL-5 モノクローナル抗体製剤であり、新たな作用機序を有する生物学的製剤で、同じ作用機序を有する医薬品はない。
- メポリズマブは新規の作用機序を有する生物学的製剤であり、全身性ステロイド薬の投与等が必要な喘息増悪をきたす患者（既存治療で喘息症状をコントロールできない難治の患者）にメポリズマブを追加して用いる。
- メポリズマブは難治性の喘息に適応を持つ長期管理薬であり、難治性喘息患者に対して、既存治療に追加して用いることにより喘息増悪発現に対する抑制効果を示す薬剤には抗 IgE 抗体（オマリズマブ）がある。
- 気管支喘息の長期管理薬の薬物群には、吸入ステロイド薬、 $\beta 2$  受容体刺激薬、ロイコトリエン受容体拮抗薬、テオフィリン徐放製剤などがある。
- オマリズマブにはショック、アナフィラキシーといった重大な副作用があるのに対し、メポリズマブによる重大な副作用は現時点で報告されていない。
- オマリズマブは患者の状態に応じて投与量と投与間隔を決める必要があるが、メポリズマブは 4 週間ごとに 1 回 100 mg と投与量と間隔が決まっている。

⑩ 同効薬はあるか？ 同効薬との違いはどこにあるか？ を参照 (p. 42)