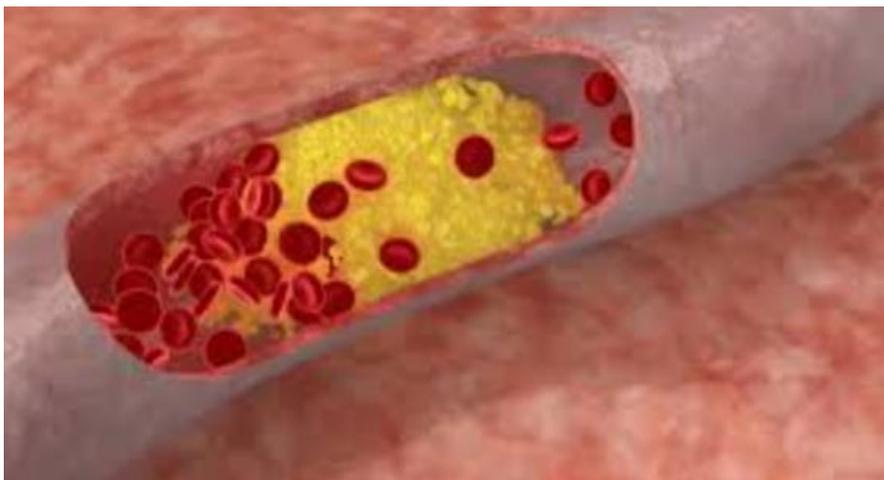


高コレステロール血症治療薬 レパーサ

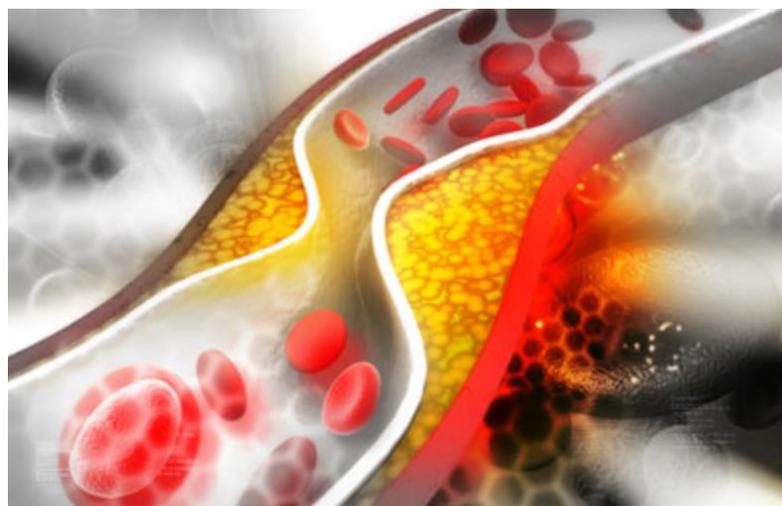
高コレステロール血症治療薬エボロクマブ
（商品名**レパーサ**皮下注 140mg シリンジ、同
皮下注 140mg ペン）の適応は「家族性高コレ
ステロール血症、高コレステロール血症（ただ
し、心血管イベントの発現リスクが高く、
HMG-CoA 還元酵素阻害薬で効果不十分な場合
に限る）」で、基本的に4週間に1回420mg
を皮下投与します。



具体的には、家族性高コレステロール血症のヘテロ接合体および高コレステロール血症患者は、2週間に1回140mgまたは4週間に1回420mgを投与。家族性高コレステロール血症ホモ接合体は、4週間に1回420mgを投与し、効果不十分な場合は2週間に1回420mgの投与も可能。低比重リポ蛋白コレステロール（LDL-C）アフェレーシスの補助として使用する場合には、開始用量として2週間に1回420mgを投与します。



今回承認された**レパーサ**は、LDL 受容体分解促進タンパク質である PCSK9（プロ蛋白転換酵素サブチリシン/ケキシン9型）をターゲットとする、**PCSK9 阻害薬**と呼ばれる新しい機序の薬剤。本薬はヒト型モノクローナル抗体製剤であり、PCSK9 と LDL 受容体の結合を阻害することで、LDL 受容体の分解を抑え、血中 LDL-C の肝細胞内への取り込みを促進する作用を持ちます。



臨床試験に参加した日本人のうち、9.9%に副作用（臨床検査値異常を含む）が認められています。主な副作用は糖尿病（1.4%）、注射部位反応・肝酵素異常・CPK 上昇・頸動脈内膜中膜肥厚度増加・筋肉痛（各 0.7%）でありました。



----- 補 足 -----

現在、LDL-C 値低下を目的とした高コレステロール血症の治療には、HMG-CoA 還元酵素阻害薬（スタチン）単独または他の作用機序が異なる薬剤を併用した、経口薬による薬物治療が基本となっています。これらの治療により、多くの患者では有意な LDL-C 値の低下が認められますが、家族性高コレステロール血症や虚血性心疾患の既往などを有する一部の患者では、LDL-C 値の低下が不十分となることが問題となっています。

家族性高コレステロール血症は、遺伝子の突然変異が原因で生じる遺伝子疾患であり、低年齢時より LDL-C 値が高くなることが知られています。

家族性高コレステロール血症患者は、コレステロール調節遺伝子の片方だけ変異しているヘテロ接合体と、調節遺伝子が両方変異しているホモ接合体の2つに分かれます。

患者はヘテロ接合体の方が多く、日本では約500人に1人の割合で発症しています。またホモ接合体は、LDL-C値が正常値の6倍を超えることもあり、より重篤な症状を伴うことが報告されています。