

2005年7月7日

報道関係各位

グリベックの新剤形「グリベック[®]錠100mg」新発売

ノバルティス ファーマ株式会社（代表取締役社長：馬場宣行）は、すでに販売している慢性骨髄性白血病（CML）およびKIT（CD117）陽性消化管間質腫瘍（GIST）の治療薬であるグリベック（一般名：メシル酸イマチニブ）の新剤形「グリベック[®]錠100mg」を、7月11日に新発売いたしますので、お知らせします。

「グリベック[®]錠100mg」は3月9日に承認、6月10日に薬価収載されました。効能・効果、用法・用量は、「グリベック[®]カプセル100mg」と同様で、変更はありません。

「グリベック[®]カプセル100mg」は、2001年5月に米国で承認、発売されて以来、すでに世界80カ国以上で承認されています。日本においても、2001年11月にCMLの治療薬として承認、2003年7月にはKIT（CD117）陽性GISTの追加適応も承認され、多くの患者さんの治療に貢献してまいりました。

一般的にサイズの大きな製剤や比重の軽いカプセルでは、食道通過に時間がかかり、嚥下しにくいことが知られています。ノバルティス ファーマ社（スイス）では2000年より、現行のカプセルと比較して服用しやすい小型の錠剤の開発に着手し、2002年にはカプセル剤と生物学的に同等なフィルムコート錠の開発に成功しました。

今回の錠剤の発売によってより服用しやすくなり、日本の患者さんの治療におけるベネフィットが高まると期待されます。

以上

<グリベック[®]錠 100mg 製品概要>

製 品 名： グリベック[®]錠(Glivec[®] Tablet) 100mg

一 般 名： メシル酸イマチニブ (Imatinib Mesilate)

効能・効果： 慢性骨髄性白血病、KIT 陽性消化管間質腫瘍

用法・用量：

1. 慢性骨髄性白血病 (CML)

慢性期:通常、成人にはイマチニブとして1日1回 400mg を食後に経口投与する。なお、血液所見、年齢・症状により適宜増減するが、1日1回 600mg まで増量できる。

移行期または急性期:通常、成人にはイマチニブとして1日1回 600mg を食後に経口投与する。なお、血液所見、年齢・症状により適宜増減するが、1日 800mg (400mg を1日2回) まで増量できる。

2. KIT (CD117) 陽性消化管間質腫瘍 (GIST)

通常、成人にはイマチニブとして1日1回 400mg を食後に経口投与する。なお、年齢・症状により適宜減量する。

作用機序：

- 慢性骨髄性白血病の場合：**慢性骨髄性白血病患者の95%以上には、フィラデルフィア染色体が発現している。この異常なbcr-abl遺伝子によって作られる異常なチロシンキナーゼであるBCR-ABLたんぱくのアデノシン三リン酸 (ATP) 結合部位に、グリベックは選択的に結合し、ATPがBCR-ABLに結合するのを選択的に阻害することで、基質たんぱくのアデノシンのリン酸化を阻害する。そのためシグナル伝達が選択的に阻害され、造血細胞のがん化を抑制する。
- KIT (CD117) 陽性消化管間質腫瘍の場合：**グリベックは、突然変異した c-kit 遺伝子によって作られる変異 KIT が、ATP と結合する部位に結合して、変異 KIT と ATP の結合を妨げ、異常増殖シグナルを阻害することによって腫瘍の異常増殖を食い止める。

規制区分： 劇薬、指定医薬品、処方せん医薬品

薬価収載： 2005年6月10日

薬 価： 3,348.00円

製造承認日： 2005年3月9日

発 売 日： 2005年7月11日

製造販売： ノバルティス ファーマ株式会社