

## ▼ヘパセラ錠 [内] &lt;2022.5 販売中止&gt;

【重要度】★★★ 【一般製剤名】アデホビルピボキシル (U) Adefovir Pivoxil 【分類】抗ウイルス化学療法剤

【単位】▼10mg/錠

【常用量】1回10mgを1日1回

【用法】分1

【透析患者への投与方法】HD後に10mgを週に1回 [HD後] (1,12,17,サンフォード感染症治療ガイド)

【PD】データがなく提示できず、できれば避けるが、必要なら10mgを72hr毎として注意深く観察 (17) データなし (サンフォード感染症治療ガイド)

【CRRT】データがなく提示できず、できれば避けるが、必要なら10mgを48~72hr毎として注意深く観察 (17)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 50mL/min以上: 1日1回10mg, Ccr 20~49mL/min: 10mgを2日に1回, Ccr 10~19mL/min: 10mgを3日に1回 (1)

【その他の報告】GFR 20~50mL/min: 10mgを48hr毎, GFR 20mL/min未満: 10mgを72hr毎 (12,17)

Ccr > 50mL/min: 10mgを24hr毎, Ccr 10~50mL/min: 10mgを24~72hr毎, Ccr 10mL/min未満: 10mgを72hr毎 (サンフォード感染症治療ガイド)

腎障害時にも用量を調節して適用できる (Fontaine H, et al: Transplantation 80: 1086-92, 2005 PMID: 16278590)

懸濁液の腎障害患者への適用報告 (Shiffman ML, et al: J Clin Pharmacol 51: 1293-301, 2011 PMID: 20978280)

【特徴】細胞内でアデホビルリン酸にリン酸化され、HBV-DNAポリメラーゼを選択的に阻害、あるいはDNAに取り込まれ、DNA鎖を遮断することによりHBV-DNAの複製を阻害 (1)

【主な副作用・毒性】腎不全、ファンコニー症候群、骨軟化症、脂肪肝、乳酸アシドーシス、血中リン低下、ミオパシー、消化器症状など

【安全性に関する情報】血清クレアチニン値では測定できない近位尿細管障害を早期に発見するために血清リン値、ALP等を測定する。投与後に近位尿細管でのリンの再吸収が低下することから低リン血症を認めるためである (1) 吸収を増大させる目的でピボキシル基を有し、代謝されてピバリン酸が分離し、ピバリン酸がカルニチン抱合を受けて代謝されて尿中に排泄されるため血中カルニチンが低下する可能性がある (1) 軽度の腎障害を合併したファンコニー症候群の1例 (渡邊 加奈子, 他: 日内会誌 105: 1026~33, 2016)

OAT1/3阻害剤で尿細管上皮細胞への移行を制限すると腎間質内薬物濃度が上昇し、間質の線維化を促進する (Zhou Y, et al: Toxicol Lett 2022 PMID: 35114312)

【モニターすべき項目】肝機能、肝炎の悪化、腎機能

【吸収】食事の影響を受けない (Sun DQ, et al: Br J Clin Pharmacol 63: 15-23, 2007 PMID: 16869815)

【F】58.6% (1) 約59% (U) 12~16% (Cundy KC, et al: Antimicrob Agents Chemother 39: 2401-5, 1995 PMID: 8585716)

【tmax】1.75hr (0.58~4hr) (U) 1hr (1) 腎障害患者ではtmaxが遅れる (1)

【代謝】小腸でエステラーゼによりアデホビルに代謝される (1)

【排泄】腎 (糸球体濾過、尿細管分泌) 尿中排泄率45% (U,12) 尿中未変化体排泄率60% [po, 24hrまで] (1) アデホビルとして糸球体ろ過及び尿細管分泌により腎排泄される (1)

【CL】36L/hr, 腎CL=14L/hr (1) 223±53mL/hr/kg, 腎CL 205±78mL/hr/kgで尿細管分泌される (Cundy KC, et al: Antimicrob Agents Chemother 39: 2401-5, 1995 PMID: 8585716) 反復投与で78.7L/hr (Huang J, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 52: 8-14, 2014 PMID: 24219967)

【t1/2】7.48hr (U) 7hr (12) 7~8hr (1) 【腎不全患者のt1/2】15hr (12)

【蛋白結合率】4%以下 (1,U) 5%未満 (12) ほとんど結合しない (Cundy KC, et al: Antimicrob Agents Chemother 39: 2401-5, 1995 PMID: 8585716)

【Vd】0.352~0.392L/kg (U) 0.4L/kg (12) 0.3L/kg (1) 体液量と同程度の0.42L/kg (Cundy KC, et al: Antimicrob Agents Chemother 39: 2401-5, 1995 PMID: 8585716)

【MW】501.47

【透析性】35% [4hrHD] (U,12) 透析クリアランス104mL/hr/kg (1) 吸収過程での検討であるが63%除去される (1)

【O/W係数】LogP=1.91 [1-オクタノール/リン酸buffer, pH7.0] (1)

【相互作用】OAT1の基質であり、阻害剤により排泄が遅延 (1) イブプロフェンで吸収率増大 (1)

【更新日】20220908

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院ではいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。