

▼エビビル錠 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】ラミブジン (U) lamivudine (3TC) 【分類】抗 HIV 薬 [NRTI・ヌクレオシド系]

【単位】▼150mg・▼300mg/錠

【常用量】300mg/日 [他の抗 HIV 薬と併用]

【用法】1日1~2回

【透析患者への投与方法】設定されていない (1)

【その他の報告】1日1回25mgで健康人の300mg/日相当 (Bohjanen PR, et al: Antimicrob Agents Chemother 46: 2387-92, 2002)
25mg/日もしくは75mg隔日 [HD日はHD後] (17)

【PD】10mg/日 (17) 25~50mgを24hr毎 (サンフォード感染症治療ガイド,12)

【CRRT】150mg/日 (17) 初日100mg, 以後50mg/日 (サンフォード感染症治療ガイド,12)

【保存期CKD患者への投与方法】抗 HIV に対する用量として, Ccr 50mL/min 以上: 300mg/日を分1または分2, Ccr 30~49mL/min: 150mgを1日1回, Ccr 15~29mL/min: 初回150mg, その後100mgを1日1回, Ccr 5~14mL/min: 初回150mg, その後50mgを1日1回, Ccr 5mL/min未満: 初回50mg, その後25mgを1日1回 (1) 【その他の報告】GFR>50mL/min: 150mgを12hr毎もしくは300mgを24hr毎, GFR 10~50mL/min: 150mgを24hr毎, GFR 10mL/min未満: 20mgを24hr毎 (17)

Ccr>50mL/min: 300mgを24hr毎, Ccr 10~50mL/min: 50~150mgを24hr毎, Ccr 10mL/min未満: 25~50mgを24hr毎 (サンフォード感染症治療ガイド,12)
軽度腎障害患者には200mg/日に減量 (Bouazza N, et al: Br J Clin Pharmacol 78: 847-54, 2014)

【特徴】細胞内でリン酸化され HIV 感染細胞内での半減期が約12時間の5'-三リン酸化体に変換され, HIV の逆転写酵素によりウイルス DNA 鎖に取り込まれ DNA 鎖の伸長を停止することにより HIV の複製を阻害する。三リン酸化体は HIV の逆転写酵素を競合的に阻害する。

【主な副作用・毒性】頭痛、倦怠感、不眠、めまい、食欲不振、吐き気、腹痛、下痢、発疹・じんま疹・かゆみ、気持ちが悪む、不安感、筋肉痛など

【モニターすべき項目】

【吸収】食事の影響を受けない (1)

【F】82% (1)

【Tmax】0.5~2hr (U) 空腹時1hr, 食後投与で3.2hr (U)

【代謝】代謝物のトランス-スルホキシド体には抗 HIV 活性なし (1) トランス-スルホキシド体のみが主代謝物であるが、血中濃度は不明 (U) 活性代謝物の5'-triphosphate anaboliteあり。代謝にCYPは関与していない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率73% (1) 70~80% (12) 49~85% (13) 主代謝物であるトランス-スルホキシド体の尿中排泄率5% (1) 尿中への排泄は速やかであり、48時間までに投与量の約70%が排泄され、7日間における尿中ならびに糞中累積排泄率はそれぞれ投与量の74%及び17%に相当。糸球体濾過に加えて尿細管分泌も関与 (U) 錠剤を経口投与後の尿中未変化体排泄率が70%でFが82%であるため、尿中未変化体排泄率は85% (Johnson MA, et al: Clin Pharmacokinetics 36: 41-66,1999)

【CL】399mL/min [iv] (1) 4.95mL/min/kg、腎障害で低下 (13) 20~25/hr, 約0.3L/hr/kg (Johnson MA, et al: Clin Pharmacokinetics 36: 41-66,1999) 【非腎CL/総CL】039 (1)

【t1/2】6.5~9.3hr (1) 5~11hr (12) 2.6 hr, 細胞内におけるリン酸化体 11~15hr (U) 9.11hr、腎障害で延長 (13) In vitro では HIV および HBV の寄生している細胞中での t1/2 は各々10.5~15.5hr, 17~19hr (Johnson MA, et al: Clin Pharmacokinetics 36: 41-66,1999) 【腎不全患者の t1/2】 Ccr 10~40 mL/min : 13.6hr、Ccr 10mL/min 以下のとき 19.4 hr (1,U) 非透析時 17.2hr, 透析時 5.3hr (Bohjanen PR, et al: Antimicrob Agent Chemother 46: 2387-92, 2002) Ccr <20 mL/min : 14.8hr (1) Ccr 10~40 mL/min : 約 13.6hr, Ccr 10mL/min 以下 : 19.4 hr (U) 20hr (12)

【蛋白結合率】36%以下 (1,13) 36%, 活性体では3%以下 (U) 36%以下, 腎障害で低下 (13) 36% (12)

【Vd】1.3L/kg (1,13) 25.6±6.22L/man [iv] (U) 0.8~1.3L/kg (12)

【分布】血液脳関門、胎盤を通過する (U) 脳脊髄液濃度は血漿濃度の4~8% (Johnson MA, et al: Clin Pharmacokinetics 36: 41-66,1999)

【MW】410.40

【透析性】透析による抽出率は50%であるがVdが100L/manと大きいため4時間透析では効率的には除去されない (Johnson MA, et al: Br J Clin Pharmacol 46: 21-7,1998) 【透析CL】106mL/min, 透析抽出率52.8%、HDによるAUCの減少率は24% (1) 138mL/min (Bohjanen PR, et al: Antimicrob Agents Chemother 46: 2387-92, 2002) 【透析時t1/2】5.3hr (Bohjanen PR, et al: Antimicrob Agents Chemother 46: 2387-92, 2002)

【O/W係数】0.40 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】4.3

【相互作用】ジドブジン (レトロビル) の併用投与を行ったとき、ジドブジンの最高血中濃度が28%上昇したが、ラミブジン、ジドブジンのAUCに有意な変化なし (1)

【効果発現】

【効果持続】

【備考】他の抗 HIV 薬と必ず併用すること

【更新日】20171219

※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。