

▼アクテムラ皮下注シリンジ・▼点滴静注用 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 トシリズマブ (遺伝子組換え) Tocilizumab (genetical recombination) 【分類】 ヒト化抗ヒト IL-6 レセプターモノクローナル抗体

【単位】 ▼162mg/Syr [sc], ▼200mg/V [iv]

【常用量】 ■皮下注：RA に対して1回 162mg を2週間隔で皮下注射

■点滴静注：●RAに1回 8mg/kg を4週間隔で点滴静注●全身型若年性特発性関節炎、キャッスルマン病に1回 8mg/kg を2週間隔で点滴静注 [症状により1週間まで短縮可]

■COVID-19 重症例：8mg/kg 単回

【用法】皮下注, 点滴静注

【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】減量の必要なく、効果が期待できる (美馬 亨, 他: 透析会誌 45: S485, 2012)

【保存期 CKD 患者への投与方法】設定されていない (1)

【特徴】 IgG1 サブクラスのヒト化抗 IL-6 受容体モノクローナル抗体. 既存治療で効果不十分な関節リウマチ, 多関節に活動性を有する若年性特発性関節炎, 全身型若年性特発性関節炎とキャッスルマン病に伴う諸症状及び検査所見の改善に適用される. 投与前に結核, B 型肝炎等のスクリーニングを行う

【主な副作用・毒性】 鼻咽頭炎、発疹、腹痛、掻痒症、好中球減少、咽喉炎疼痛、下痢、トリグリセリド上昇など多数

【代謝】 細胞内に取り込まれた後、リゾチームにおいてペプチドあるいはアミノ酸に分解されると推測 (1)

【排泄】 尿中には排泄されない (1)

【CL】 0.3~0.9mL/hr/kg (1)

【t_{1/2}】 74~242hr, 用量依存的に延長 (1) 週1回皮下注で13日 (Song SN, et al: Expert Opin Drug Metab Toxicol 11: 307-16, 2015 PMID: 25491492)

【蛋白結合率】 不明 (1)

【Vd】 55~100mL/kg (1)

【MW】 148,000

【透析性】 分子量が大きく透析されないとされる (5) 資料なし (1)

【薬物動態】 線形, 非線形消失を含む2-コンパートメントモデルに適合 (Frey N, et al: J Clin Pharmacol 50: 754-66, 2010 PMID: 20097931)

皮下投与時の PK (Zhang X, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 51: 443-55, 2013 PMID: 23547848)

皮下投与での個体間変動が大きく, 全身 CL は, 体重, 炎症, ACR 値などと関連 (Arrive C, et al: BioDrugs 2024 PMID: 39147956)

【O/W 係数】 該当しない (1)

【相互作用】 MTX の PK に影響しない (Schmitt C, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 50: 218-23, 2012 PMID: 22373834)

炎症性サイトカインにより CYP3A4 活性の抑制を解除することで, 基質薬物の CL が増大する可能性がある (Schmitt C, et al: Clin Pharmacol Ther 2011 PMID: 21430660)

【主な臨床報告】 RA への適用のレビュー (Plushner SL: Ann Pharmacother 42: 1660-8, 2008 PMID: 18957621, Oldfield V, et al: Drugs 69: 609-32, 2009 PMID: 19368420) RA への週1回皮下投与時の効果 (Zhang X, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 51: 620-30, 2013 PMID: 23782588)

皮下投与時の効果は点滴静注投与と同等であり RA 治療の選択肢となる (Ogata A, et al: Arthritis Care Res (Hoboken) 2014 PMID: 23983039)

COVID-19 治療において, 重症例の90日予後を改善 [REMAP-CAP] (N Engl J Med 2021 PMID: 33631065)

【更新日】 20240817

※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。