

○バラクルード錠 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】エンテカビル 水和物 (U) Entecavir Hydrate (ETV) 【分類】抗ウイルス化学療法剤 [B型肝炎]

【単位】0.5mg/錠

【常用量】1日1回0.5mg [ラミブジン不応患者には1mg/日]

【用法】1日1回 空腹時 投与 [食後2時間以降かつ次の食事の2時間以上前]

【透析患者への投与方法】0.5mgを7日に1回 (U) HD例にはHD後の空腹時投与 (1)

【その他の報告】腎機能正常患者と比べて透析患者において特徴的な副作用は特定されていない (1)

0.5mgを5~7日毎 (17)

HD患者に適用した症例 (Spaziante M, et al: J Med Virol 86: 139-43,2014 PMID: 24136393)

【PD】0.5mgを週1回投与が適用可能と思われる (加藤華浩, 他: 透析会誌 45:S964,2012)

【保存期CKD患者への投与方法】それぞれ1回0.5mg (ラミブジン不応患者には1mg) を, Ccr 30~50mL/min 未満: 2日に1回, Ccr 10~30mL/min 未満: 3日に1回, Ccr 10mL/min 未満: 7日に1回 (1)

【その他の報告】GFR>50mL/min : 0.5mg/日, GFR 30~50mL/min : 0.25mg/日か0.5mgを48hr毎, GFR 10~29mL/min : 0.15mg/日か0.5mgを72hr毎 (17)

ラミブジン不応例にはGFR>50mL/min : 1mg/日, GFR 30~50mL/min : 0.5mg/日, GFR 10~29mL/min : 0.3mg/日か0.5mgを48hr毎 (17)

【特徴】B型肝炎ウイルスの増殖を伴い肝機能の異常が確認されたB型慢性肝疾患におけるB型肝炎ウイルスの増殖抑制に適用される。グアノシンと類似したヌクレオシド誘導体HBVのDNAポリメラーゼを阻害する。HIV感染者では使用できない。

【主な副作用・毒性】アナフィラキシー, 乳酸アシドーシス, 倦怠感, 脂肪肝, 消化器障害, 肝障害, 過敏症, 頭痛, めまい, 下痢, 鼻咽頭炎など

【吸収】食事により吸収率低下[AUC20%低下] (1) 食事によりAUCが22%低下するので空腹時投与がよい (Zhang QH, et al: Arzneimittelforschung 60: 640-4, 2010 PMID: 21125816) 食後投与によってもウイルス学的有効性は低下しない (Cho EJ, et al: Drug Des Devel Ther 2018 PMID: 30464407)

【F】100% (U) 70%以上 [液剤] (1)

【tmax】1~1.5hr (U) 0.5~1.5hr (1)

【代謝】代謝物が同定されていないが, グルクロン酸包合体, 硫酸包合体は存在する (1,U) CYP酵素への影響はない (1,U)

【排泄】尿中未変化体排泄率78~80% (1) 62~73% (U, Yan JH, et al: J Clin Pharmacol 46: 1250-8, 2006 PMID: 17050790) 尿細管分泌も関与する (1,U) OAT2の基質 (Furihata T, et al: Drug Metab Pharmacokinet 2017 PMID: 27916488)

OAT1/3とOAT2により尿細管細胞に取り込まれ, MATEs, MDR1, MRP2により分泌され, OCTN1/2は分泌と再吸収に関与すると思われる (Yang X, et al: Antimicrob Agents Chemother 2016 PMID: 27503646)

【CL/F】588mL/min (1) 腎CL=505mL/min (1) 26.4L/hr (Yoshitsugu H, et al: Diagn Microbiol Infect Dis 70: 91-100, 2011 PMID: 21513847)

【t1/2】128~149hr (U) 83.3~96.9hr (1)

【蛋白結合率】13% (1,U)

【Vd】大きい (U) Vd/F=2466L/man (1)

【MW】295.3

【透析性】Vdが大きいため透析されにくいと思われる (5) HDで投与量の約13%, CAPDで投与量の約0.3%が除去 (1)

【TDMのポイント】エンテカビル血中濃度とウイルス学的効果は必ずしも相関せず (Boglione L, et al: Int J Antimicrob Agents 2016 PMID: 27444118)

【O/W係数】0.15 [1-オクタノール/buffer, pH7.1] (1)

【相互作用】

【更新日】20220303

※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。