

△ビビアント錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】バゼドキシフェン酢酸塩 Bazedoxifene Acetate 【分類】骨粗鬆症治療剤 [SERM]

【単位】△20mg/錠

【常用量】20mg/日

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】安全性が確立されていないため慎重投与であるが減量の必要なし (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】安全性が確立されていないため慎重投与であるが減量の必要なし (1)

【その他の報告】軽度～中等度腎障害は有効性と安全性に影響しない (Adami S, et al: Climacteric 17: 273-84, 2014 PMID: 23937421)

経ロクリアランスと Ccr は弱い相関 (McKeand W, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2018 PMID: 30144296)

【特徴】選択的エストロゲン受容体モジュレーター (SERM)。閉経後骨粗鬆症の治療に用いられる。

【主な副作用・毒性】筋痙攣、線維囊胞性乳腺疾患、血管拡張 (ほてり)、静脈血栓塞栓症、発疹、消化器症状、霧視、視力低下など

【安全性に関する情報】静脈血栓塞栓症のリスクのため寝たきり患者には不適 (5) トリグリセリド上昇に注意 (1)

【吸収】食事により AUC は増加するが臨床効果を左右するものではない (1)

【F】6% (1, McKeand W: Clin Ther 2017 PMID: 28756067)

【tmax】2～3hr (1)

【代謝】グルクロン酸抱合される (1) 肝、十二指腸、空腸で、UGT1A1, 1A8, 1A10 により 4-グルクロナイド、5-グルクロナイドに代謝され [肝では 4-グルクロナイドが優位]、P-gp の基質である可能性 (Shen L, et al: Drug Metab Dispos 2010 PMID: 20516255) 代謝物に活性はない (1) UGT1A1*28 多型が代謝クリアランス低下に関与 (Lusin TT, et al: Pharmazie 70: 94-6, 2015 PMID: 25997248)

【排泄】糞便中に排泄され、未変化体としては尿中にほとんど排泄されない (1) 尿中回収率 1%未満 (1)

【CL/F】4～7L/hr/kg (1)

【t1/2】23～35hr (1)

【蛋白結合率】98～99% (1)

【Vd】14.7±3.9L/kg [iv] (1)

【MW】530.65

【透析性】除去されないと思われる (5) 資料なし (1)

【TDM のポイント】IC50 は 500pg/mL 程度で 5mg/日反復投与時のトラフ濃度に相当、IC90 は 1000pg/mL 程度で 10mg/日反復投与時のトラフ濃度に相当 (1)

【O/W 係数】1000 以上 [1-オクタノール水系、pH6.56] (1)

【相互作用】P-gp の基質であると思われる (Shen L, et al: Drug Metab Dispos 38: 1471-9, 2010 PMID: 20516255)

【肝障害患者における情報】血中濃度が上昇するおそれがあるため慎重投与 (1)

【備考】Ca、ビタミン D の摂取にも配慮 (1)

【更新日】20240120

※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。