

▼ストックリン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エファビレンツ (U) Efavirenz 【分類】 抗 HIV 薬 [NNRTI]

【単位】 ▼600mg/錠

【常用量】 600mg/日

【用法】 1日1回 [精神神経系症状の副作用対策のため就寝前の投与が推奨]

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (1,12,サンフォード感染症治療ガイド)

【PD】 減量の必要なし (12)

【CRRT】 減量の必要なし (12)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (1,12,サンフォード感染症治療ガイド)

【特徴】 NNRTI で逆転写酵素の基質結合部位近傍に結合し、逆転写酵素活性を非競合的に阻害する。

【主な副作用・毒性】 SJS, 多形紅斑, 肝障害, 体脂肪の再分布/蓄積, 頭痛, 倦怠感, ぼてり, 消化器症状, 動悸, 関節痛, 感覚鈍麻, 中枢神経症状, 体重減少など多数

【吸収】 高脂肪食で F が上昇する可能性 (1, 抗 HIV 薬治療ガイドライン 2012) $ka=0.3/hr$ (Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140)

【F】資料なし (抗 HIV 薬治療ガイドライン 2012) 個体間変動は大きい、個体内変動は小さい (Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140)

【tmax】 4hr (1)

【代謝】 CYP2B6, 3A4 で代謝され、3A4 を誘導、阻害する (1, 抗 HIV 薬治療ガイドライン 2012) 代謝物は 7-水酸化体、8-水酸化体で活性はなく、これらはグルクロン酸抱合、グルタチオン抱合、硫酸抱合、シスチニルグリシン抱合を受ける (1) CYP3A4, 2B6 の誘導剤である (1) 水酸化されさらに抱合される (U)

【排泄】 尿中回収率 0.01%以下 [po, 24hr まで] (1) 尿中未変化体排泄率 1%未満 (12) 尿中に代謝物として 14~34%回収 (U)

【CL】 0.68L/hr/kg [iv, サル] (1) $CL/F=9.4L/hr$ (Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140)

【t1/2】 78hr (1) 40~75hr (12) 単回 52~76hr, 反復 40~55hr (U)

【蛋白結合率】 99%以上 (1,12) 99.5% [Alb] (U)

【Vd】 資料なし (1) 252L/man (Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140) 4L/kg (12)

【MW】 315.67

【透析性】 除去されないと思われる (1)

【OW係数】 $\text{LogP}=5.4$ [1-オクタノール/水系] (1) 【TDMのポイント】有効治療域 1~4ng/mL (Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140)

【相互作用】 CYP2C19 や 3A4 の誘導作用がある (Michaud V, et al: Clin Pharmacol Ther 91: 475-82, 2012) CYP 3A4, 2B6, P-gp の誘導剤 (1) 多種の薬物間相互作用がある (12)

【更新日】 20210811

※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・配言を禁じます。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。