

▼ソブリアードカプセル [内] <販売中止>

【重要度】 【一般製剤名】シメプレビルナトリウム Simeprevir Sodium 【分類】抗ウイルス薬 [C型慢性肝炎治療薬:PI]

【単位】▼100mg/Cap

【常用量】100mg/日 [PEG-IFN α + リバビリンとの3剤併用で通常12週間, その後PEG-IFN α + リバビリンの2剤で12週間]

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】併用するリバビリンが禁忌 (1)

【その他の報告】減量の必要なし (サンフォード感染症治療ガイド)

【保存期CKD患者への投与方法】併用するリバビリンが禁忌 (1) 高度腎障害 (Cr 29mL/min 以下) 患者のAUCはCr 80mL/min以上の患者に比べて1.62倍高値 (1, Ouwerkerk-Mahadevan S, et al: Drugs R D 15: 261-70, 2015 PMID: 26248593) 【その他の報告】減量の必要なし (サンフォード感染症治療ガイド)

【特徴】セログループ1 [ジェノタイプI (1a) またはII (1b)] のC型慢性肝炎にPEG-IFN + リバビリンに併用して適用されるプロテアーゼ阻害剤。HCVの複製に必要なセリン・プロテアーゼを直接阻害し, ウイルス増殖を抑制する。血中HCV-RNA量が高値の未治療患者 (5Log以上に相当) もしくはインターフェロンを含む治療法で無効または再燃となった患者のウイルス血症の改善に適用。

【主な副作用・毒性】貧血, 多形紅斑, 便秘, 発疹, 光線過敏, 血中ビリルビン増加, 敗血症, 脳出血など

【吸収】ka=0.37/hr (1)

【F】70%程度が吸収されると推測 (1)

【tmax】6hr (1)

【代謝】主にCYP3Aにより代謝され, 2C8, 2C19も関与 (1) 血中における代謝物の存在比は小さい (1) P-gp, OATP1B1の基質で, CYP3A, P-gp, OATP1B1を阻害する (1) CYP3A4, OATP1B1/1B3の基質であり飽和して非線形動態となる (Snoeys J, et al: Clin Pharmacol Ther 99: 224-34, 2016 PMID: 26259716)

【排泄】尿中回収率1%未満 (1) 糞中未変化体排泄率31% [po] (1) 尿中未変化体排泄率0.009~0.138% [po] (Ouwerkerk-Mahadevan S, et al: Drugs R D 15: 261-70, 2015 PMID: 26248593)

【CL/F】2~2.7L/hr (1)

【t1/2】8.5hr (1)

【蛋白結合率】99.9%以上 [主にAlb] (1)

【Vd/F】中央23.5L/man, 末梢32.2L/man [血管外投与] (1)

【MW】771.92

【透析性】蛋白結合率が高いため除去されないと思われる (1)

【O/W係数】 1.07×10^4 以上 [1-オクタノール/リン酸buffer, pH7.0] (1)

【相互作用】CYP3A4の強力な誘導剤との併用禁忌 (1) P-gp, OATP1B1の基質であり, CYP3A4, P-gp, BCRP, OATP1B1を阻害する (1) OATP1B1およびBCRP阻害によりロスバスタチンの排出が阻害されて血中濃度上昇 (1)

【更新日】20241012

※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。