

▼アイセントレス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ラルテグラビルカリウム *raltegravir potassium* 【分類】 抗 HIV 薬 [インテグラーゼ阻害剤]

【単位】 ▼400mg/錠

【常用量】 1回 400mg, 1日 2回 [他の抗 HIV 薬と併用]

【用法】 1日 2回

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

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (1, サンフォード感染症治療ガイド) PK への影響はなく減量の必要なし (Iwamoto M, et al: *Antimicrob Agents Chemother* 53: 1747-52, 2009)

【特徴】 HIV-1 の複製に必要な 3 つの酵素のうちの 1 つであるインテグラーゼの阻害剤。他のクラスの薬剤 (NRTI、NNRTI、PI) と交差耐性を示さず、多剤耐性ウイルスにも効果が認められる。

【主な副作用・毒性】 SJS, 薬剤性過敏症候群, 横紋筋融解症, ミオパチー, 腎不全, 肝炎, 胃炎, 陰部ヘルペス, 貧血, 動悸, めまい, 消化器症状, 脂肪肝, 倦怠感, 関節痛, うつ, 女性化乳房など多数

【吸収】 食事の影響を受けて体内動態はばらつくが, 食事に関係なく服用して良い (1) 腸管の pH 上昇により溶解性が増して吸収が増大 (Moss DM, et al: *J Antimicrob Chemother* 68: 1627-34, 2012)

【F】 データなし (1)

【tmax】 3hr (1)

【代謝】 UGT1A1 によりグルクロン酸抱合される (1) C 型肝硬変患者で AUC が増大 (Hernandez-Novoa B, et al: *J Antimicrob Chemother* 69: 471-5, 2014) UGT1A1 でグルクロン酸抱合される (Kassahun K, et al: *Drug Metab Dispos* 35: 1657-63, 2007) UGT1A1 の活性低下多型 [*28/*28] の影響は軽度であり用量調節の必要はない (Wenning LA, et al: *Clin Pharmacol Ther* 85: 623-7, 2009) PK に UGT1A9*3 多型が関連する可能性 (Arab-Alameddine M, et al: *Antimicrob Agents Chemother* 56: 2959-66, 2012)

【排泄】 尿中回収率 32%, 糞中回収率 51% [po] (1) 尿中回収物は未変化体として 9%, グルクロン酸抱合体として 23% (Kassahun K, et al: *Drug Metab Dispos* 35: 1657-63, 2007) 尿中未変化体排泄率 7~14% (Iwamoto M, et al: *Clin Pharmacol Ther* 83: 293-9, 2008) P-gp の基質にならない (Dupuis ML, et al: *BMC Pharmacol Toxicol* 14: 47, 2013)

【t1/2】 α 相 1hr, β 相 9hr (1) 7~12hr (Iwamoto M, et al: *Clin Pharmacol Ther* 83: 293-9, 2008)

【蛋白結合率】 83% (1)

【Vd】 BBB を通過しにくい (1) 中枢に移行するが移行率の個人差が大きい (Calcagno A, et al: *J Antimicrob Chemother* 69: 241-5, 2014)

【MW】 482.51

【透析性】 データなし (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象にはならないが, 血中濃度の個人差は大きい (Fortuna S, et al: *Pharmacology* 92: 43-8, 2013) 中枢移行には関係しないが血中濃度には ABCB1 の遺伝的多型が関係する (Johnson DH, et al: *PLoS One* 8: e82672, 2013) 100mg/12hr でのトラフ濃度は 33nM 以上 (Iwamoto M, et al: *Clin Pharmacol Ther* 83: 293-9, 2008) PK には個体間・個体名変動が大きい (Cattaneo D, et al: *J Antimicrob Chemother* 67: 460-4, 2012) 肝・腎機能障害患者では TDM が望まれる (Pau AK, et al: *Pharmacotherapy* 32: e1-6, 2012)

【OW 係数】 2.80 [1-オクタノール水系, pH7.4] (1)

【相互作用】 Mg, Al とキレート形成して吸収が抑制される (1) UGT1A1 誘導剤 [リファンピシン等] により血中濃度低下 (1) ミダゾラムとの相互作用を認めない (Iwamoto M, et al: *J Clin Pharmacol* 48: 209-14, 2008) オメプラゾール併用で血中濃度上昇 [溶解が pH 依存的] (Iwamoto M, et al: *Clin Infect Dis* 48: 489-92, 2009) リファンピシンとの併用は禁忌ではないが, 血中濃度低下による作用減弱の可能性がある (Wenning LA, et al: *Antimicrob Agents Chemother* 53: 2852-6, 2009) ラモトリギンとの相互作用を認めない (van Luin M, et al: *J Clin Pharmacol* 49: 1220-7, 2009) カチオン性制酸剤との相互作用を認めない (Kiser JJ, et al: *Antimicrob Agents Chemother* 54: 4999-5003, 2010)

【更新日】 20240730

※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。