

▼インビラーゼカプセル, ▼錠 [内] <製造中止>

【重要度】 【一般製剤名】 サキナビルメシル酸塩 (U) saquinavir mesilate 【分類】 抗HIV薬 [PI]

【単位】 ▼200mg/cap, ▼500mg/錠

【常用量】 1回1000mgを1日2回 [リトナビルとして1回100mgを1日2回]

【用法】 1日2回食後2時間以内 [他の抗HIVと併用]

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

【PD】 データはないが減量の必要なし (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 (12, サンフォード感染症治療ガイド)

【特徴】 HIV プロテアーゼ阻害剤。吸収率が低い (初回通過効果が高い) ため、リトナビルと併用で用いられる。

【主な副作用・毒性】 自殺企図, 錯乱痙攣, 協調運動障害, 膝炎, 腸管閉塞, 腹水, 肝機能障害, 汎血球減少症, 血栓性静脈炎, 腎結石症, 傾眠, 振戦, 味覚異常, 浮動性めまい, 下痢, 貧血, 高脂血症, 筋痙攣, 浮腫など多数

【吸収】 初回通過効果を受ける (U) 高脂肪食で吸収率上昇 (1) 空腹時に服用すると血中濃度が低くなり抗ウイルス作用を発揮できないことがあるため食後2hr以内に服用する (1)

【F】 4% (1)

【tmax】 4hr [2~6hr] (1)

【代謝】 90%以上がCYP3A4で代謝される (U) CYP3A4で不活性なモノ及びジ水酸化体へ代謝される (1) CYP3A5*1 遺伝子型はCL/Fの上昇に関連する (Mouly SJ, et al: Clin Pharmacol Ther 78: 605-18, 2005) CYP3A5の多型でCLが低下 (Josephson F, et al: Clin Pharmacol Ther 81: 708-12, 2007)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 4%未満 (12) 88%が未変化体および代謝物として糞便中に排泄 (U) 尿中未変化体排泄率 1%未満 [po, 5日まで] (U) 尿中回収率 3% [iv, 5日まで] (1)

【CL】 1.14L/hr/kg [iv] (1)

【t1/2】 7~12hr, ESRDで12hr (12) MRT 7hr (1)

【蛋白結合率】 98% (1,12,U)

【Vd】 700L/man [iv] (1,U) 10L/kg (12)

【MW】 766.95

【透析性】 蛋白結合率が高く除去されない (5) 資料なし (1)

【TDMのポイント】 TDMの対象薬ではない。有効治療血中濃度 50~100ng/mL以上 [AUC0-24: 20,000 ng・hr/mL以上] (1) 【O/W係数】 LogP=2.12 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】 7.01

【相互作用】 CYP3A4の競合拮抗作用がある (1) P-gpの基質である (1)

【更新日】 20190408

※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。