

▼アデムバズ錠 [内]

【重要度】★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】リオシグアト Riociguat 【分類】肺高血圧症治療薬 [可溶性GC 刺激剤]

【単位】▼0.5mg・▼1.0mg・▼2.5mg/錠

【常用量】1回1mg, 1日3回から開始, 血圧により1回量を0.5mgずつ漸増し最大1回2.5mg, 1日3回

■状態に応じて開始量はさらに減量を考慮

■3日以上中断した場合の再開用量に注意

【用法】1日3回 (6~8hr あける)

【透析患者への投与方法】使用経験がなく血中濃度上昇のおそれがあり禁忌 (1)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 15~80mL/min : 通常の開始量を下回る低用量からの開始を考慮 (1)

Ccr 15mL/min 未満 : 使用経験がなく血中濃度上昇のおそれがあり禁忌 (1)

低用量から開始する場合は1回0.5mgを1日3回で開始 [opinion] (1)

【その他の報告】Ccr 80mL/minを下回るとAUCが増大するデータ (1)

【特徴】外科的治療不適応または再発の慢性血拴性肺高血圧症 (CTEPH) に適用されるsGC刺激剤。血圧の低下は投与初期に多い。喫煙者では血中濃度が低下するので禁煙させることが望ましい。

【主な副作用・毒性】咯血, 肺出血, 頭痛, めまい, 消化器症状, 鼻出血, 鼻閉, 低血圧, 動悸, 呼吸困難, 貧血, 浮腫, 疲労など

【吸収】食事によりtmaxが遅延してCmaxが低下するが, AUCに影響なし (1) ka=2.15/hr (1)

【F】94.3% (1)

【tmax】1~1.5hr (1)

【代謝】CYP1A1, 2C8, 2J2, 3Aにより代謝 (1) 主にCYP1A1で脱メチル化されて主代謝物M-1 [活性あり] となり, その後UGT1A1・1A9でグルクロン酸抱合されM-4が生成 (1) 喫煙者でAUCが低下する (Zhao X, et al: Clin Pharmacokinetics 2015 PMID: 26507720)

【排泄】尿中未変化体排泄率4~19% [po] (1) M-1として7~23%が尿中に回収 (1) P-gp/BCRPの基質 (1)

【CL】1.82L/hr (1)

【t1/2】4~8hr (1) 高齢者で12hrに延長 (1)

【蛋白結合率】95% [Alb, AAG] (1)

【Vd】0.38L/kg (1)

【MW】422.42

【透析性】資料なし (1) PBRが高く, 除去されないとされる (5)

【薬物動態】線形動態 (Zhao X, et al: Clin Pharmacokinetics 2015 PMID: 26507720)

【O/W係数】2.37 [1-オクタノール/buffer, pH 7.0] (1)

【相互作用】NO 供与剤, PDE5 阻害剤, CYP3A4 を強く阻害する薬剤との併用禁忌 (1) 本剤及び主代謝物M-1はCYP1A1阻害作用を有する (1) CYP1A1阻害剤 [エルロチニブ, ゲフィチニブ] と併用注意 (1) シクロスポリンのP-gp, BCRP阻害により本剤のCLが低下 (1) 金属カチオン系制酸剤により吸収率低下 (1) CYP3A4の阻害剤, 誘導剤の影響を受ける (1) 未変化体と主代謝物M-1はCYP1A1阻害作用を有する (1) 喫煙によりCYP1A1が誘導されクリアランスが上昇 (1) ワルファリンとの相互作用を認めない (Frey R, et al: J Clin Pharmacol 51: 1051-60, 2011 PMID: 20801938) P-gpの基質であり, 誘導剤や阻害剤の影響を受ける可能性 (Rickert V, et al: Pulm Pharmacol Ther 28: 130-7, 2014 PMID: 24657506)

【肝障害患者における情報】重度の肝障害患者では使用経験がなく, 本剤の血中濃度が著しく上昇するおそれがあるため禁忌 (1)

【更新日】20210729

※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。