

▼ジャカビ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ルキシロチニブ リン酸塩 ruxolitinib phosphate 【分類】 抗悪性腫瘍剤ヤヌスキナーゼ (JAK) 阻害剤

【単位】 ▼5mg/錠

【常用量】 ■骨髄線維症：1回5～25mgの範囲で適宜増減し、1日2回12hr毎 [血小板数により開始量決定]

■真性多血症：1回10mgから会誌し、1日2回12hr毎 [最大1回25mg, 1日2回] [血小板数, Hbにより開始量決定]

【用法】 1日2回 [12hr毎]

【透析患者への投与方法】 透析患者では血中濃度が上昇するおそれがあり慎重投与 (1)

【保存期 CKD患者への投与方法】 Cr 30mL/min未満では血中濃度が上昇するおそれがあり慎重投与 (1) 腎機能低下により代謝物合計のAUCが増大する (1)

【特徴】 骨髄線維症に適用される JAK 阻害剤。

【主な副作用・毒性】 骨髄抑制 [血小板減少症, 貧血, 好中球減少], 感染症, 出血, 進行性多巣性白質脳症, 間質性肺炎, 肝機能障害, 心不全, 体重増加, 低Ca血症, 頭痛, めまい, 動悸, 高血圧, 下痢, 悪心・嘔吐, 寝汗, 筋肉痛, 疲労など多数

【安全性に関する情報】 好中球減少は可逆的 (Ogama Y, et al: Int J Hematol 97: 351-9, 2013 PMID: 23381973)

【吸収】 高脂肪食により Cmax が軽度低下するが AUC は不変 (Shi JG, et al: J Clin Pharmacol 51: 1644-54, 2011 PMID: 21257798)

【F】 95%以上が吸収されると推測 (Shilling AD, et al: Drug Metab Dispos 38: 2023-31, 2010 PMID: 20699411)

【tmax】 0.5hr (1) 1hr 以内 (Shilling AD, et al: Drug Metab Dispos 38: 2023-31, 2010 PMID: 20699411)

【代謝】 CYP3A4 で代謝され、一部 2C9 でも代謝される (1) 腸の CYP3A4, P-gp, BCRP を阻害する可能性が示唆 (1) 主に未変化体で存在し、その他に2種の水酸化代謝物が同定 (Shilling AD, et al: Drug Metab Dispos 38: 2023-31, 2010 PMID: 20699411)

【排泄】 尿中回収率 74%で、未変化体としては1%未満 [po, 196hr まで] (1) 尿中排泄はほとんどない (Shi JG, et al: J Clin Pharmacol 51: 1644-54, 2011 PMID: 21257798)

【CL/F】 18.5 ± 6.5L/hr [po] (1)

【t1/2】 2～4hr (1) 3hr (Shi JG, et al: J Clin Pharmacol 51: 1644-54, 2011 PMID: 21257798) α相 2.3hr, β相 5.8hr (Shilling AD, et al: Drug Metab Dispos 38: 2023-31, 2010 PMID: 20699411)

【蛋白結合率】 96.8% (1) 腎機能低下の影響を受けない (1)

【Vd】 Vc=58.6L/man, Vt=11.2L/man (1)

【MW】 404.36

【透析性】 除去されないが、代謝物には透析性がある (1)

【薬物動態】 100mg まで線形動態で人種差なし (Ogama Y, et al: Int J Hematol 97: 351-9, 2013 PMID: 23381973)

【O/W 係数】 2.814 [1-オクタノール/buffer, pH7.4] (1)

【相互作用】 CYP3A4, 2C9 阻害剤により血中濃度上昇の可能性 (1) CYP3A4 誘導剤により血中濃度低下の可能性 (1) CYP3A4 の強力な阻害剤併用時には投与量を50%に減量するが、その他の阻害剤や誘導剤による影響は小さい (Shi JG, et al: J Clin Pharmacol 52: 809-18, 2012 PMID: 21602517)

【更新日】 20170123

※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。