

▼テビケイ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ドルテグラビルナトリウム Dolutegravir Sodium 【分類】 抗 HIV 薬 [インテグラーゼ阻害剤]

【単位】 ▼50mg/錠

【常用量】 ■未治療患者，インテグラーゼ阻害薬以外の抗 HIV 薬による治療経験のある患者：50mg を 1 日 1 回

■インテグラーゼ阻害薬に対する耐性を有する患者：50mg を 1 日 2 回

【用法】 1 日 1 回または 2 回

【透析患者への投与方法】 標準用量でよいだろう (Kreft KN, et al: Int J STD AIDS 2019 PMID: 31074360)

HD 除去されず，常用量適用可 (Molto J, et al: Antimicrob Agents Chemother 2016 PMID: 26856824)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 重度の腎障害患者の Cmax, AUC は低下するが用量調節の必要はない (1)

【その他の報告】 OCT2 を阻害してクレアチニンの分泌が抑制され血清クレアチニンが上昇 (Koteff J, et al: Br J Clin Pharmacol 2013 PMID: 22905856)

Ccr 30mL/min 未満の患者でも血中濃度は軽度上昇するのみであり，常用量が適用できる [グルクロン酸抱合体も上昇] (Weller S, et al: Eur J Clin Pharmacol 2014 PMID: 24096683)

【特徴】 HIV インテグラーゼ阻害により抗ウイルス活性を示す。インテグラーゼは宿主感染細胞の染色体にウイルス DNA が組み込まれる過程を触媒する。

【主な副作用・毒性】 薬剤性過敏症候群，免疫再構築炎症反応症候群，頭痛，不眠，めまい，異常な夢，悪心，嘔吐，下痢，鼓腸，腹部不快感，腹痛，肝炎，発疹，そう痒，疲労，ビリルビン上昇，クレアチニン上昇など

【吸収】 ka=2.24/hr (1)

【F】 データなし (1)

【tmax】 2~3hr (1)

【代謝】 肝臓で主に UGT1A1 でグルクロン酸抱合される (1) UGT1A1 の基質で，CYP3A4 でもわずかに代謝 (1) OCT2, MATE1 を阻害 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1%未満 [po] (1)

【CL/F】 0.56L/hr (1)

【t1/2】 14~15hr (1) 13~14hr (Cottrell ML, et al: Clin Pharmacokinetics 2013 PMID: 23824675)

【蛋白結合率】 99.3% (1)

【Vd/F】 懸濁剤 12.5L/man [0.17L/kg] (1) 錠剤 17.4L/man (1)

【MW】 441.36

【透析性】 除去されない (Bollen PD, et al: AIDS 2016 PMID: 27167013)

【薬物動態】 抗ウイルス効果はトラフ濃度と相関 (Cottrell ML, et al: Clin Pharmacokinetics 2013 PMID: 23824675)

【O/W 係数】 LogP=2.16±0.01 (1)

【相互作用】 OCT2 及び MATE1 の阻害作用によりピルシカイニドの排出が阻害される可能性 (1) 多価カチオン含有製剤による吸収阻害 (1) 経口投与前 2hr, 後 6hr は制酸剤の投与を避ける (Cottrell ML, et al: Clin Pharmacokinetics 2013 PMID: 23824675)

【更新日】 20240731

※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。