

## ▼ラパリムス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 シロリムス (ラパマイシン) sirolimus 【分類】 リンパ管筋腫症治療剤 (mTOR 阻害剤)

【単位】 ▼1mg/錠

【常用量】 2mg/日 [最大 4mg/日]

【用法】 1日1回 ■食後か空腹時どちらかに定める

【透析患者への投与方法】 データはないが減量の必要はないと思われる (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 データはないが減量の必要はないと思われる (1)

【特徴】 免疫抑制作用を有するマクロライド。 mTOR 阻害作用を有しリンパ管筋腫症 (LAM) における LAM 細胞の増殖及び転移を抑制することにより病態の進行を抑制する分子標的治療剤。

【主な副作用・毒性】 間質性肺疾患、感染症、口内炎、下痢、悪心、嘔吐、PML、体液貯留、脂質異常症、腎障害、ざ瘡、創傷治癒不良など

【安全性に関する情報】 トラフ濃度や投与量の増加に伴い、間質性肺疾患の発現リスクが増加する可能性がある (1)

【吸収】 高脂肪食により吸収 (Cmax, AUC) が増大するので、服用タイミングを空腹時か食後かで一定にする (1)

【F】 初回通過効果を受け、19% (1)

【tmax】 2.75hr (1)

【代謝】 CYP3A4 により代謝 [O-脱メチル化] (1) 代謝物の活性はごく弱い (1) CYP3A5 の寄与は 3A4 よりかなり小さい (Emoto C, et al: Br J Clin Pharmacol 80: 1438-46, 2015 PMID: 26256674)

【排泄】 尿中回収率 2.2% [po] (1) P-gp の基質 (1)

【CL/F】 156±41mL/hr/kg [po] (1)

【t1/2】 47.7±41hr (1)

【蛋白結合率】 60%で、リポプロテインにも結合し、遊離型分率は 2.5% (1)

【Vd/F】 9.0±6.5L/kg [po] (1)

【MW】 914.17

【透析性】 資料なし (1) 除去されないとと思われる (5)

【薬物動態】 腎移植時の PPK (Wang M, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 54: 433-41, 2016 PMID: 27117038)

【OW 係数】 LogP=4.02 [1-オクタノール水系] (1)

【相互作用】 生ワクチンの接種不可 (1) CYP3A4, P-gp 阻害剤や誘導剤との併用注意 (1) シクロスポリンの用量増加により AUC 増大 [CL/F 低下] (Wang M, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 54: 433-41, 2016 PMID: 27117038) CYP3A4 阻害剤のボサコナゾール併用により AUC が 8.9 倍に上昇 (Moton A, et al: Curr Med Res Opin 25: 701-7, 2009 PMID: 19196220)

【更新日】 20170130

※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。