

▼プララエント皮下注シリンジ [注]

- 【重要度】 【一般製剤名】 アリロクマブ (遺伝子組換え) alirocumab (genetical recombination) 【分類】 脂質異常症治療薬 [抗 PCSK9 抗体]
- 【単位】 ▼75mg・▼150mg/Syr [1mL]
- 【常用量】 75mg を 2 週に 1 回 [効果不十分な場合 1 回 150mg に増量可]
- 【用法】 2 週に 1 回、皮下注 ■スタチンと併用 ■アフェレーシス併用時は、アフェレーシス後の投与
- 注射部位は大腿部、腹部又は上腕部 (同一部位に繰り返し注射しない) ■遮光した状態で室温に戻してから投与
- 【透析患者への投与方法】 設定されていない (1)
- 【その他の報告】 減量の必要はないと思われるが場合によっては投与間隔を延長 (5)
- 【保存期 CKD 患者への投与方法】 軽度～中等度腎機能障害患者では、腎機能正常者に比べ AUC が 1.5～2 倍程度に上昇するものの、腎機能は PK の説明変数とは同定されていない (1)
- 【その他の報告】 減量の必要はないと思われるが場合によっては投与間隔を延長 (5)
- 【特徴】 CHO 由来のヒト型抗 PCSK9 モノクローナル抗体。PCSK9 が媒介する LDL 受容体の分解を阻害し、LDL 受容体数を増加させ、肝への LDL コレステロールの取り込みを促進して血中 LDL コレステロールを低下させる。心血管イベント発現リスクが高く、スタチンで効果不十分な家族性高コレステロール血症、高コレステロール血症に適用される。家族性高コレステロール血症のうちホモ接合体については有効性及び安全性が確立していない。IgG1 型。
- 【主な副作用・毒性】 アレルギー反応 (過敏症、貨幣状湿疹、蕁麻疹、過敏性血管炎等)、かゆみ、胃腸炎、うっ血性心筋症、上気道炎、糖尿病、肝機能異常、注射部位反応、前立腺炎、末梢性浮腫、CK 上昇など
- 【安全性に関する情報】 注射部位異常が 12% に発現 (Kastelein JJ, et al: Eur Heart J 36: 2996-3003, 2015 PMID: 26330422) 糖尿病発症率の上昇は認められない (Colhoun HM, et al: Eur Heart J 2016 PMID: 27460890)
- 【モニターすべき項目】 血中コレステロール、抗アリロクマブ抗体・中和抗体の出現
- 【吸収】 注射部位による PK に差はない (Lunven C, et al: Cardiovasc Ther 32: 297-301, 2014 PMID: 25256660)
- 【F】 53～86% [sc] (1)
- 【tmax】 5～7 日 (1)
- 【代謝】 内因性の免疫グロブリンと同様の軽度で低分子ペプチド及びアミノ酸へ分解されると推察 (1)
- 【排泄】 資料なし (1)
- 【CL】 6.20～3.17mL/day/kg [iv] (1)
- 【t1/2】
- 【蛋白結合率】 資料なし (1)
- 【Vd】 0.04～0.05L/kg (1)
- 【MW】 約 149,000
- 【透析性】 資料なし (1) 除去されないと思われる (5)
- 【O/W 係数】 資料なし (1)
- 【肝障害患者への投与方法】 使用経験がないため、重度の肝障害患者には慎重投与 (1)
- 【小児における情報】 安全性未確立 (1)
- 【妊婦・授乳婦における情報】 スタチンと併用するため、実質使用できない (1)
- 【主な臨床報告】 75mg/2 週の 24 週単独治療により LDL-C は 50% 以上の低下を示した [エゼチミブとの比較] (Roth EM, et al: Int J Cardiol 176: 55-61, 2014 PMID: 25037695) スタチン併用下での心血管ハイリスク患者への投与による LDL-C 低下作用はエゼチミブよりも強力 (Cannon CP, et al: Eur Heart J 36:1186-94, 2015 PMID: 25687353) 150mg/2 週 [+スタチン最大量] により LDL-C の低下と主要心血管イベントのリスクの 48% 低下が確認 [プラセボ対照] (Robinson JG, et al: N Engl J Med 372: 1489-99, 2015 PMID: 25773378) 86% の患者は 75mg/2 週で目標 LDL-C レベルに到達 (Bays H, et al: J Clin Endocrinol Metab 100: 3140-8, 2015 PMID: 26030325) GOF 変異患者でも有効 (Hopkins PN, et al: Circ Cardiovasc Genet 8: 823-31, 2015 PMID: 26374825) 日本人におけるアトルバスタチンへの上乗せによる臨床試験 [P1～2] (Teramoto T, et al: Am J Cardiol 118: 56-63, 2016 PMID: 27184170) 日本人における 52 週までの RCT (Teramoto T, et al: Circ J 2016 PMID: 27452202)
- 【更新日】 20200330

※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。