

▼グラジナ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 グラゾプレビル水和物 grazoprevir hydrate 【分類】 抗ウイルス薬 [HCV]

【単位】 ▼50mg/錠

【常用量】 100mg/日, 12 週間■エルバスビルと必ず併用

【用法】 1 日 1 回

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (1, Landaverde C, et al: Expert Rev Gastroenterol Hepatol 10: 419-29, 2016 PMID: 26818134)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【その他の報告】CKDG4/5 患者への通常治療スケジュール[グラゾプレビル 100mg+エルバスビル 50mg を 12 週間]による良好な治療成績 (Roth D, et al: Lancet 386: 1537-45, 2015 PMID: 26456905)

【特徴】ウイルス複製に必要な成熟したウイルス蛋白産生のための HCV ポリ蛋白プロセッシングに関与する NS3/4A プロテアーゼに対する阻害薬で、セログループ 1 (ジェノタイプ 1) の C 型慢性肝炎又は C 型代償性肝硬変におけるウイルス血症の改善に適用。

【主な副作用・毒性】 肝機能障害, 倦怠感, 疲労, 下痢, 便秘, 発疹, 頭痛, めまい, 鼻咽頭炎, 血中ビリルビン増加など

【安全性に関する情報】

【吸収】 $ka=0.278\sim0.698/hr$ (1)

【F】 15~27% (1)

【 t_{max}] 2hr (1)

【代謝】 一部が CYP3A により代謝 [誘導はしない] (1)

【排泄】 尿中回収率 1%未満 (1) 90%以上が糞便中に排泄 (1)

【トランスポーター】 P-gp, OATP1B1 の基質 (1)

【CL】 20~40L/hr [iv] (1)

【 $t_{1/2}$] 36hr [健常人] (1)

【蛋白結合率】 98%以上 [Alb, AAG] (1)

【Vd】 $V_{ss}/F=1230L/man, 3600L/man$ [iv] (1)

【MW】 784.92 [hydrate]

【透析性】 除去率 0.5%未満で透析されない (1)

【O/W 係数】 $\log P=3.24$ (1)

【相互作用】 併用禁忌薬が多数あり要注意 (1) 腸管 BCRP を阻害する可能性 (1) OATP1B1 を阻害しない (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】 妊婦には有益性投与。授乳は避ける (1)

【主な臨床報告】 日本人における臨床試験 [phase II/III] 成績 (Kumada H, et al: J Gastroenterol 2016 PMID: 27873094)

【更新日】 20170426

※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。