

▼ウプトラビ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】セレキシパグ Selexipag 【分類】肺動脈性肺高血圧症治療薬 [選択的プロスタサイクリン受容体作動薬]

【単位】▼0.2mg・▼0.4mg/錠

【常用量】■1回0.2mg, 1日2回から開始して漸増

■忍容性を確認しながら7日以上の間隔で1回0.2mgずつ最大耐用量まで増量して維持用量を決定

■最大1回1.6mg, 1日2回

■減量後の再増量や中断後の再開については添付文書参照

【用法】1日2回, 食後

【透析患者への投与方法】使用経験がなく慎重投与 (1)

【その他の報告】PK データからは高度腎障害患者でも減量の必要はない (Kaufmann P, et al: Br J Clin Pharmacol 2016 PMID: 27062188)

【保存期CKD患者への投与方法】重度の腎障害患者では血中濃度上昇のため慎重投与 (1)

【その他の報告】PK データからは高度腎障害患者でも減量の必要はない (Kaufmann P, et al: Br J Clin Pharmacol 2016 PMID: 27062188)

【特徴】肺動脈性肺高血圧症に適用される非プロスタノイドのプロスタサイクリン受容体 (IP 受容体) 作動薬。プロドラッグであり作用時間が長い。

【主な副作用・毒性】低血圧, 出血, 甲状腺機能異常, 貧血, 体液貯留, 食欲低下, めまい, 頭痛, ほてり, 右心不全, 呼吸困難, 下痢, 嘔吐, 口腔乾燥, 肝酵素上昇, 皮膚障害, 筋肉痛, 疲労など

【安全性に関する情報】投与初期に頭痛, 下痢が多い (1)

【吸収】食事により活性代謝物のAUCが27%低下 (Kaufmann P, et al: Am J Cardiovasc Drugs 2015 PMID: 25850750) 食事によるAUCへの影響は存在するが小さい (1)

【F】49.4% (1)

【tmax】未変化体1.5hr, 活性代謝物4hr (1) 未変化体2.5hr, 活性代謝物4hr (Kaufmann P, et al: Am J Cardiovasc Drugs 2015 PMID: 25850750)

【代謝】加水分解により活性代謝物を生成 (1) 本剤及び活性代謝物 [脱メチルスルホニルアミド体 (MRE-269)] はCYP2C8とCYP3A4により代謝 (1) MRE-269はUGT1A3とUGT2B7によりグルクロン酸抱合される (1) 活性代謝物の活性は未変化体の15倍 (1)

【排泄】尿中に未変化体は排泄されない [po] (1) 活性代謝物およびそのグルクロン酸抱合体は尿中に0.27%以下が回収 [po, 48hrまで] (1) 尿中回収率12% [po, 168hrまで] (1)

【CL】17.93L/hr [iv] (1)

【t1/2】未変化体1~1.5hr, 活性代謝物8~10hr (1) 未変化体0.7~2.3hr, 活性代謝物9.4~14.22hr (Kaufmann P, et al: Am J Cardiovasc Drugs 2015 PMID: 25850750)

【蛋白結合率】98~99% (1)

【Vd】11.73L/man [iv] (1)

【MW】496.62

【透析性】資料はないが, 蛋白結合率が高いため除去されないと思われる (1)

【薬物動態】線形で活性代謝物のAUCは未変化体の4倍 (Bruderer S, et al: Pharmacology 2014 PMID: 25277144)

【O/W係数】LogP=2.2 [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】降圧作用を有する薬剤との併用で過度の血圧低下の可能性 (1) OATP1B1/1B3, P-gp, CYP3A4 関連の相互作用の可能性は低い (Kaufmann P, et al: Br J Clin Pharmacol 2015 PMID: 25851691) クロピドグレル代謝物のCYP2C8阻害による活性代謝物AUC上昇のため1日1回に減量して投与開始 (1)

【肝障害患者への投与方法】中等度の肝障害患者には1日1回に減量して投与を開始し, 投与間隔や増量間隔の延長, 最高用量の減量を考慮 (1)

【小児CKD患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】

【主な臨床報告】死亡または肺動脈性高血圧症に関連する合併症のリスクがプラセボに比べ有意に低かった [GRIPHON] (Sitbon O, et al: N Engl J Med 2015 PMID: 26699168)

ベラプロストからセレキシパグへの切り替えにはメリットがある可能性 (Tamura Y, et al: Pharmaceuticals (Basel) 2024 PMID: 38794126)

【更新日】20241022

※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。