

▼ジャクスタピッドカプセル [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】ロミタピド メシル酸塩 Lomitapide Mesilate 【分類】高脂血症治療剤 [ホモ接合体家族性高コレステロール血症治療薬]

【単位】▼5mg・▼10mg・▼20mg/cap

【常用量】5mg/日から開始。忍容性に問題がなく効果不十分な場合には2週間以上の間隔をあけて10mgに増量。さらに増量が必要な場合には4週間以上の間隔で忍容性を確認しながら段階的に20mg、40mgに増量可

【用法】1日1回夕食後から2時間以上あけて経口投与

【透析患者への投与方法】血中濃度が上昇するおそれがあり慎重投与 (1) 半減期は変わらないが、Cmax 1.5倍、AUC1.4倍に上昇 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】血中濃度が上昇するおそれがあり慎重投与 (1)

【特徴】小胞体内腔に存在するミクロソームトリグリセリド転送タンパク質 (MTP) に直接結合することにより、肝細胞及び小腸上皮細胞内においてトリグリセリドとアポ蛋白 B (apo B) を含むリポタンパク質への転送を阻害する。その結果、肝細胞の VLDL や小腸細胞のカイロミクロンの形成が阻害され、VLDL の形成が阻害されると VLDL の肝臓からの分泌が低下し、血漿中 LDL-C が低下する。

【主な副作用・毒性】肝炎、肝機能障害、胃腸障害、疲労、倦怠感、脂肪肝、感染症、体重減少、頭痛、平衡障害、不眠、頻尿、鉄欠乏性貧血など多数

【安全性に関する情報】肝機能検査を定期的実施 (1) 胃腸障害低減のため、服用中は低脂肪食を指導 (1) 小腸における脂溶性栄養素の吸収が低下するおそれがあるため、食事に加えてビタミン E、リノール酸、αリノレン酸 (ALA)、エイコサペンタエン酸 (EPA) 及びドコサヘキサエン酸 (DHA) を毎日摂取するよう指導 (1) ビタミン K の吸収が低下し出血が発現するおそれがあるため定期的に PT/INR を測定し出血の発現に注意 (1) 主な副作用は肝障害と消化器障害 (Taubel J, et al: J Atheroscler Thromb 23: 606-20, 2016 PMID: 26686567) QT 延長に関連しない (Darpo B, et al: Ann Noninvasive Electrocardiol 18: 577-89, 2013 PMID: 24118671) 消化器症状は低脂肪食により軽減 (Stefanutti C, et al: J Clin Lipidol 10: 782-9, 2016 PMID: 27578108)

【吸収】食事により吸収が増大 [特に高脂肪食] (1)

【F】7% (1)

【tmax】4~6hr (1)

【代謝】CYP3A により活性がない2種類の主代謝物 [M1 及び M3] に変換され、さらに代謝を受ける (1)

【排泄】尿中回収率 35.1% [po] で、主に M1 (1)

【CL/F】300L/hr (1)

【t1/2】50~60hr (1)

【蛋白結合率】99.5% (1)

【Vd/F】1200L/kg (1)

【MW】789.83

【透析性】資料なし (1) 除去されないと思われる (5)

【薬物動態】10~60mg の範囲で線形で人種差なし (Taubel J, et al: J Atheroscler Thromb 23: 606-20, 2016 PMID: 26686567)

【O/W 係数】169 [pH5.5, pH が低くなると低下 (1)]

【相互作用】CYP3A, 2C9, P-gp を阻害する (1) CYP3A4 の弱い阻害剤であり、CYP3A4 で代謝されるスタチンとの併用時には注意して観察 (Tuteja S, et al: Pharmacotherapy 34: 227-39, 2014 PMID: 24734312) 中程度または強い CYP3A 阻害作用を有する薬剤は併用禁忌 (1)

【肝障害患者への投与方法】

【小児 CKD 患者における報告】安全性未確立 (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦に禁忌、授乳は避ける (1)

【主な臨床報告】

【更新日】20240626

※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。