

## ○ベクルリー点滴静注用 [注]

【重要度】★ 【一般製剤名】レムデシビル Remdesivir 【分類】抗ウイルス薬

【単位】○100mg/V

【常用量】

■体重 40kg 以上：初日 200mg/日 1 回，2 日目以降 100mg/日

■体重 3.5kg 以上 40 kg 未満の小児：初日 5mg/kg，2 日目以降 2.5mg/kg/日

ECMO 又は侵襲的人工呼吸器管理が導入されている患者では総投与期間は 10 日間まで

ECMO 又は侵襲的人工呼吸器管理が導入されていない患者では 5 日目まで

症状の改善が認められない場合には 10 日目まで投与

【用法】1 日 1 回

注射用水で溶解，生食に添加して 30～120 分かけて点滴静注（成人は生食を添加して全量 250mL とする）

Infusion Reaction，アナフィラキシーを含む過敏症発現を防止するため緩徐に点滴

点滴静注用は注射用水 19mL で溶解

【透析患者への投与方法】有益性投与 (1) 残腎機能を保護するの必要がなければおそらく減量の必要はない (5)

投与を避ける (Roberto P, et al: Intern Emerg Med 2020 PMID: 32986137)

100mg を HD4 時間前に点滴投与し，死亡率改善は得られなかったが，入院から 48hr 以内に開始した場合には入院期間の短縮効果あり，肝障害の出現なし (Aiswarya D, et al: Kidney Int Rep 2021 PMID: 33354635)

腎機能正常者に比べ HD 患者での未変化体 AUC は 3 倍，代謝物 GS-44154 の AUC は 6 倍高いが臨床試験での許容範囲内であり，未変化体の半減期が短いことと，代謝物の透析性があるためそれぞれの蓄積性は認めず (Sorgel F, et al: J Antimicrob Chemother 2021 PMID: 33251541)

初回 200mg (中等症 I～)，以後 100mg/日 [HD 日は HD 後投与でよいだろう] (5)

未変化体の血中濃度は健康人と同程度で (半減期 1hr から 2hr に延長)，不活性代謝物 GS-441524 濃度は数倍に上昇 (AUC が通常の 5～10 倍) であるが，肝傷害などの毒性が何と関連しているのかが明らかでない (Davis MR, et al: J Antimicrob Chemother 2021 PMID: 33152758)

【保存期 CKD 患者への投与方法】eGFR30 未満：投与を推奨しない [有益性投与] (1) 添加物 SBCECD 蓄積により腎機能障害が悪化するおそれあり (1)

CCr 30 以上は常用量，未満は投与を避ける (Roberto P, et al: Intern Emerg Med 2020 PMID: 32986137)

AKI に対して防御的に作用する可能性 (Yin L, et al: Front Immunol 2021 PMID: 34093539)

代謝物および添加物の蓄積性を考慮し，CKDG4/5 では初回負荷量を回避することも検討 (5)

【特徴】アデノシンヌクレオシドのプロドラッグ。三リン酸化体が RNA 依存性 RNA ポリメラーゼによりウイルス RNA に取り込まれ，RNA の伸長を阻害する。

【主な副作用・毒性】Infusion reaction，肝機能障害，AKI 等

【安全性に関する情報】哺乳類の DNA や RNA ポリメラーゼの阻害作用は弱いものの，テノホビルのように腎尿管上皮細胞のミトコンドリア機能障害の可能性があるので長期使用は制限されているが，現在のところ腎毒性は報告されていない (Adamsick ML, et al: J Am Soc Nephrol 2020 PMID: 32513665)

AKI の報告オッズ比は約 20 倍 [対照薬 ヒドロキシクロロキン，トシリズマブ，ロピナビル/リトナビル] (Gerard AO, et al: Clin Pharmacol Ther 2021 PMID: 33340409)

代謝物 GS-44154 は AKI の原因ではなく，Captisol と GS-704277 が関与しているそう (Yan VC, et al: Antimicrob Agents Chemother 2020 PMID: 32988821)

凍結乾燥品に比べて注射液では SBCECD を 2 倍含有するが，製剤による AKI 頻度には差がない (Shah S, et al: Antimicrob Agents Chemother 2021 PMID: 34310212)

【モニターすべき項目】定期的に腎機能検査

【F】

【tmax】

【代謝】主にカルボキシエステラーゼ 1 (CES1) にて加水分解 (1) 代謝物ヌクレオシド類似体，細胞内での三リン酸化体が活性体 (1) 最終的に脱リン酸化され，再リン酸化されないヌクレオシド代謝物 (GS-441524) が生成 (1)

一部はカタレプシン A (CatA) や CYP3A により代謝 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 10%，ヌクレオシド類似体 (GS-441524) として 49% 回収 [iv] (1) OATP1B1，P-gp の基質 (1)

【t1/2】活性体として細胞内で 35～50hr，ヌクレオシド体として血中 25hr，細胞内 35～40hr (Le MP, et al: Antimicrob Agents Chemother 2020 PMID: 32868327)

【蛋白結合率】88～93% (1)

【Vd】未変化体 93L/body (Humeniuk R, et al: Clin Pharmacokinetics 2021 PMID: 33782830)

【MW】602.58

【透析性】ヌクレオシド体の除去率 59%，代謝物 GS-44154 と SBCECD は除去できる (Le MP, et al: Antimicrob Agents Chemother 2020 PMID: 32868327)

【薬物動態】線形動態 (1)

【O/W 係数】LogP=3.2 (1)

【相互作用】CYP2C8，2D6，3A4，OATP1B1，P-gp の基質 (1) CYP3A4，OATP1B1・1B3，BSEP，MRP4 及び NTCP の阻害剤 (1) 発売時，相互作用の検証未 (1) ヒドロキシクロロキン: 本剤の抗ウイルス効果減弱の可能性 (1) P-gp 阻害薬との併用による薬剤性肝障害の症例 (Leegwater E, et al: Clin Infect Dis 2021 PMID: 33340409)

32594120)

【主な臨床報告】 SARS-CoV-2 への EC50 は 460ng/mL (Le MP, et al: Antimicrob Agents Chemother 2020 PMID: 32868327)

ステロイド併用に関係なく、生存率を改善させず、入院期間が長くなる (Ohl ME, et al: JAMA Netw Open 2021 PMID: 34264329)

【備考】点滴静注液は冷所保存. 点滴静注用は室温保存. SBECD は約 3g/100mg 含有しており、ポリコナゾール注の 3.2g/200mg と同等. 溶解後室温で 24 時間、冷所で 48hr 安定.

【更新日】 20220411

---

※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。