

▼メーゼント錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】シポニモド フマル酸塩 Siponimod Fumaric Acid [BAF312] 【分類】多発性硬化症治療薬

【単位】▼0.25mg・▼2mg/錠

【常用量】0.25mg/日から開始，2日目に0.25mg，3日目に0.5mg，4日目に0.75mg，5日目に1.25mg，6日目に2mg，7日目以降は2mg/日で維持（適宜減量）

■投与開始前にCYP2C9遺伝子型を確認し，PMでは5日目以降1mg/日で維持

【用法】1日1回 朝■心拍数減少作用があり，夜間の徐脈を避けるために朝に服用

【透析患者への投与方法】常用量（1）

【保存期CKD患者への投与方法】常用量（1）腎機能障害のPKへの影響を認めず（Gardin A, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2017 PMID: 27841151）

【特徴】スフィンゴシン-1-リン酸（S1P）受容体の特定サブタイプに対する選択的免疫調節薬。リンゴ球上のS1P1サブ受容体に結合しリンゴ球が中枢神経系に移行することを防ぐ。徐脈の発現を最小限にするため，漸増法が設定されている（Legangneux E, et al: Br J Clin Pharmacol 2013 PMID: 22845008）

【主な副作用・毒性】感染症，末梢リンゴ球数減少，黄斑浮腫（眼科医と連携），徐脈性不整脈（房室伝導遅延）（循環器医と連携），QT延長，悪性リンパ腫，PML，頭痛，めまい，痙攣，振せん，高血圧，消化器症状，末梢性浮腫，肝機能検査値異常など

【安全性に関する情報】QT延長に関連する薬剤との併用を避ける（1）過量投与時hバイタル+ECGチェック（1）投与初期のめまい，ふらつきに注意（1）

【吸収】食事の影響を受けない（1）

【F】84%（1）

【tmax】4hr（1）服用後6hr後付近で心拍数低下作用が最大になる（1）

【代謝】主にCYP2C9（79.3%）で代謝され，CYP3A4（18.5%）も一部関与（1, Glaenzel U, et al: Drug Metab Dispos. 2018 PMID: 29735753） CYP2C9*3*3を保有者には禁忌（1）

【排泄】尿中未変化体排泄率0%，ほぼ糞便中排泄され，尿中には代謝物が回収（1）

【CL/F】3.3L/hr（1）

【t1/2】30～40hr（1）CYP2C9*3*3では126hrまで延長（Gardin A, et al: Clin Pharmacokinet 2019 PMID: 30088221）

【蛋白結合率】99.9%（1）

【Vd】124L/body [iv]（1）

【MW】1149.26

【透析性】除去されない（1）

【O/W係数】

【相互作用】QT延長関連薬剤，心拍数減少関連薬剤との薬力学的影響あり（1）抗不整脈薬のIa群，III群，ベプリジルと併用禁忌（1）CYP2C9や3A4阻害剤・誘導剤との併用注意（1）経口避妊薬との相互作用を認めず（Biswal S, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2014 PMID: 25161159）定常状態にてプロプラノロールを追加した場合の心拍数への影響は相対的に軽度（Biswal S, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2015 PMID: 26308174）フルコナゾール併用でAUC2倍（Jin Y, et al: Eur J Clin Pharmacol 2018 PMID: 29273968）CYP関連の相互作用の強度予測に関する報告（Huth F, et al: Clin Pharmacol Ther 2019 PMID: 31199498）

【肝障害患者への投与方法】遊離型薬物濃度のAUCが肝機能障害により増大するが用量調節の必要はないと思われる（Shakeri-Nejad K, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2017 PMID: 27443658）

【小児CKD患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦に禁忌，授乳を避ける（1）

【主な臨床報告】

静注製剤の開発についての検証（Shakeri-Nejad K, et al: Clin Ther 2020 PMID: 31926605）

【備考】冷所貯蔵で，交付後は25℃以下で保存可。8℃を超え25℃以下で保存する場合には3ヵ月以内に使用（1）

【更新日】20220113

※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。