

▼ジセレカ錠 [内]

【重要度】★★★透析患者に投与禁忌 【一般製剤名】フィルゴチニブ マレイン酸塩 Filgotinib Maleate 【分類】ヤヌスキナーゼ (JAK) 阻害剤

【単位】▼100mg・▼200mg/錠

【常用量】200mg/日

状態に応じて100mg/日

【用法】

【透析患者への投与方法】eGFR15未満では禁忌 [PKも検討されていない] (1)

【保存期CKD患者への投与方法】eGFR15～60：100mg/日 [CKD G4での適用は慎重に判断]，eGFR15未満：禁忌 (1)

【その他の報告】高度腎機能低下例では代謝物血中濃度が上昇 (Namour F, et al: Br J Clin Pharmacol 2018 PMID: 30088677)

【特徴】主にJAK1を選択的に阻害するRA治療薬。MTXで効果不十分、bDMARDで効果不十分で明らか症状を認める活動性RAに適用。

【主な副作用・毒性】

【安全性に関する情報】QT延長に関与しない (Anderson K, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2020 PMID: 31797578)

【F】41% [ラット] (1) 80%以上と推測 (1)

【tmax】0.5～1hr (1)

【代謝】カルボキシエステラーゼで代謝を受け大部分がGS-829845として存在 (1) GS-829845のJAK阻害活性は未変化体の1/10 (1)

【排泄】尿中に未変化体として9.4%、GS-829845として54%回収 [po]，トータルの尿中回収率87% [po] (1)

未変化体、GS-829845はP-gpの基質 (1)

【t1/2】未変化体：5～6hr，GS-829845：17～20hr (1)

【蛋白結合率】未変化体55～59%、GS-829845：39～44% (1)

【Vd/F】未変化体：25L，GS-829845：165L/body (1)

【MW】541.58

【透析性】資料なし (1) 一部は除去されると思われる (1)

【O/W係数】Log P=1.4 [1-オクタノールpH7.4 リン酸buffer] (1)

【相互作用】CYP、トランスポーター関連の相互作用のポテンシャルは低い (Namour F, et al: Drug Metab Lett 2016 PMID: 26693854)

【主な臨床報告】

【更新日】20210717

※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。