

## ▼サイバインコ錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】アブロシチニブ Abrocitinib 【分類】アトピー性皮膚炎治療薬 [JAK 阻害剤]

【単位】▼50mg・▼100mg・▼200mg/錠

【常用量】1日1回100mg [最大200mg/日]

[強いCYP2C19阻害薬と併用投与する場合は50mg/日]

【用法】1日1回

■12週までに効果判定

■他の免疫抑制剤との併用は行わない(局所製剤は可)

■結核、ウイルス感染症の事前チェック後に開始

【透析患者への投与方法】活性成分の曝露量が増大するため慎重に判断し、50mg/日(1)

【保存期CKD患者への投与方法】eGFR30~60未満:50mg/日で最大100mg, eGFR<30:50mg/日, いずれも慎重に観察(1)

活性体濃度から中等度~高度腎障害時には50%ほど減量(Wang EQ, et al: J Clin Pharmacol 2022 PMID: 34637151)

【特徴】経口ヤヌスキナーゼ阻害剤(JAK1選択性が高い)。アトピー性皮膚炎でのJAK/STAT経路による免疫応答を阻害し、既存治療で効果不十分なアトピー性皮膚炎に適用される。

【主な副作用・毒性】感染症、皮膚の感染症、静脈血栓塞栓症、血球減少症、間質性肺炎、消化管穿孔、肝機能障害、消化器症状、頭痛、浮動性めまい、疲労など多数

【安全性に関する情報】

【吸収】食後・高脂肪食で吸収増大(1)

【F】約60%(1)

【tmax】1hr(1)

【代謝】CYP2C19[寄与率約53%], 2C9[寄与率約30%]で代謝(1)未変化体と同等の活性を有する代謝物M-1, M-2が同定されており, 血中存在比は未変化体の半分程度(1)

【排泄】尿中未変化体排泄率1%未満(1)P-gpを阻害する(1)代謝物はOAT3を介して主に尿中に回収(1)P-gp, BCRPの基質(1)

【CL】未変化体として1073mL/min [iv](1)

【t1/2】4.3~5.9hr(1)

【蛋白結合率】64%(1)37% [M1], 29% [M2](1)

【Vd】約100L/body [iv](1)

【MW】323.41

【透析性】資料なし(1)一部が除去されるが未変化体の除去は効率的ではないと思われる(5)

【O/W係数】1.66 [1-オクタノール/水系](1)

【相互作用】CYP2C19の強い阻害薬と併用注意(1)CYP2C19, 2C9を誘導する薬剤との併用注意(1)OAT3を阻害するプロベネシド併用により主として活性代謝物の尿中排泄が阻害され活性体としてのAUCが増大(1)P-gp, BCRP, OAT3, OCT1, MATE1, MATE2-Kを阻害(1)フルボキサミン併用で作用増強の可能性があり併用しない(1)

【肝障害患者への投与方法】

【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】JSK阻害剤のTEN治療への応用の可能性(Nordmann TM, et al: Nature 2024 PMID: 39415009)

【備考】同効薬としてバリシチニブ, ウパダシチニブがある

【更新日】20241106

※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。