○パキロビッド パック　［内］

【重要度】★★　【一般製剤名】ニルマトレルビル／リトナビル　Nirmatrelvir　(PF-07321332; NMV)／Ritnavir（RTV）　【分類】抗ウイルス薬［プロテアーゼ阻害剤＋リトナビル］

【単位】○600 ニルマトレビル 300mg（150mg×2 錠）＋リトナビル 100mg（1 錠）/1 回分，○300 ニルマトレビル 150mg（150mg×1 錠）＋リトナビル 100mg（1 錠）/1 回分（それぞれ 1 パック＝1 日分シート）

【常用量】ニルマトレルビルとして 1 回 300mg 及びリトナビルとして 1 回 100mg を同時に 1 日 2 回、5 日間

■SARS-CoV-2 陽性で，重症化リスクを有する成人および 12 歳以上で 40kg 以上の小児に適用（軽症～中等症）

■患者の併用薬を全て確認

有症状の軽症～中等症 I かつ，重症化リスク因子を有する例に適用可

【用法】1 パックを 1 日 2 回，5 日間（期間延長なし）

発症から 5 日以内に開始

●食事に関係なく服用（12 時間ごとと考えて）

●2 種類の錠剤は同じタイミングで服用（間隔を空けない）

【透析患者への投与方法】データが得られていないため推奨しない（1）

腎機能低下時に RTV で代謝を阻害すると消失が延長しやすい可能性あり，その場合は NMV 150mg 単位では調整しにくい可能性があるが，NMV として常用量の 1/4 量への減量が提案されている（5）

初回 300/100mg，以後 150/100mg1 日 1 回（HD 日は HD 後）の選択が可能かもしれない［体重 40kg 未満には 150/100mg を 48hr 毎］（Hiremath S, et al: Clin J Am Soc Nephrol 2022 PMID: 35680135）

1 回 150/100mg1 日 2 回投与時のニルマトルビルのピーク濃度は 4563～7898 ng/mL で，HD 後低下．血中濃度は最大 4 倍まで上昇したが，腎障害のない例の範囲内（Lingscheid T, et al: Antimicrob Agents Chemother 2022 PMID: 36286542）

HD 例に 1 日 1 回 150mg/100mg を 5 日間で COVID-19 治療が可能かもしれない（Hao X, et al: Front Med 2024 PMID: 37978164）

【保存期 CKD 患者への投与方法】

eGFR 30 以上～60 未満：1 回量としてニルマトレビルを 1 錠（150mg）に減量［300 を使用］（1）

eGFR＜30：データが得られていないため推奨しない（1）

腎機能障害例への PK study からの減量提案（Toussi SS, et al: Clin Pharmacol Ther 2022 PMID: 35712797）

腎機能障害を有するコルヒチン使用例には使用しない（1）

eGFR 30 未満では初回 300/100mg，以後 150/100mg1 日 1 回が提案（Hiremath S, et al: Clin J Am Soc Nephrol 2022 PMID: 35680135）

eGFR 30 未満への COVID-19 治療においてモルヌピラビルより死亡，入院の絶対リスクが有意に低い（Chu WM, et al: EClinicalMedicine 2024 PMID: 38737003）

CKD 患者の死亡リスク 22%低下（Cheng FWT, et al: Kidney Int Rep 2024 PMID: 38707795）

【特徴】ニルマトレルビルは SARS-CoV-2 の 3- キモトリプシン様システインプロテアーゼ main protease（Mpro）の阻害剤でウイルスの複製を阻害する．リトナビルは CYP3A 阻害のブースター．COVID-19 の重症化予防，入院・死亡リスクの低下が期待される．予防投与は適応外．リトナビルは抗 HIV 薬の標準用量より低用量である．

【主な副作用・毒性】肝機能障害，下痢，血圧上昇，筋肉痛，味覚障害など．味覚不全が最も多く，次いで，下痢や軟便が多いが，COVID-19 感染症の症状と重複している可能性がある．味覚不全はおそらくリトナビルによるものと推測されている．

【安全性に関する情報】

【F】NMV 単独の場合，初回通過効果を受けて 8.5%［サル］doi: https://doi.org/10.1101/2021.07.28.21261232

【tmax】NTV 3hr（1）

【代謝】NMV は一部が CYP3A4 で代謝，RTV の代謝には CYP3A，2D6 が関与（1）NMV は主に CYP3A4 で代謝（Eng H, et al: Drug Metab Dispos 2022 PMID: 35153195）

【排泄】■NMV 尿中回収率 50%で大部分が未変化体（1）P-gp の基質で阻害剤（1）糞便中に 35%回収（1）■RTV 尿中回収率 11.3%で未変化体として 3.5%（1）

【t1/2】■NMV 6～7hr（1）NTV100mg に RTV100mg 併用した場合，eGFR 30-59 で 10hr，eGFR 30 未満で 13.4hr に延長（1）

単独投与で 0.79hr［サル］doi: https://doi.org/10.1101/2021.07.28.21261232

■RTV 6hr（1）

【蛋白結合率】NMV 69%，RTV 99%以上（1）

【Vd/F】NMV 105L/body，RTV 112L/body（1）0.33L/kg［サル，iv］doi: https://doi.org/10.1101/2021.07.28.21261232

【MW】

【透析性】NMV の PBR が中等度，Vd/F が大きいものの F が小さいため，除去率最大 30%程度と推測（5）

【O/W 係数】

【相互作用】併用薬の CYP3A4 代謝依存性，誘導能により評価

https://www.covid19treatmentguidelines.nih.gov/therapies/statement-on-paxlovid-drug-drug-interactions/

リトナビルはグルクロン酸抱合を促進させ，CYP1A2，2C9，2C19 を誘導
相互作用の面から抗てんかん薬使用例には他剤を考慮（Wanounou M, et al: Clin Pharmacokinet 2022 PMID: 35895276）
リバーロキサバン（併用終了後 4 日間持続），R-ワルファリン（併用終了後約 2 週間持続）との相互作用は大きい（Wang Z, et al: Clin Pharmacol Ther 2022 PMID: 35712802）
CNI の用量調整の上使用された 14 名（Devresse A, et al: Kidney Int Rep 2022 PMID: 36060621）

【肝障害患者への投与方法】
肝機能障害を有するコルヒチン使用例には使用しない（1）
【小児 CKD 患者における報告】
【妊婦・授乳婦への投薬】有益性を評価（1）
【主な臨床報告】発症後 3 日以内の開始で 28 日後までの入院・死亡の ARR 約 6%，RRR 89%（Hammond J, et al: N Engl J Med 2022 PMID: 35172054）

モルヌピラビル/レムデシビルと比べ，比較ウイルスクリアランスに優れている（Bai F, et al: Infect Dis Ther 2024 PMID: 38829439）
オミクロン株流行下での入院患者への適用で心血管および呼吸器合併症が軽減していた（Wang H, et al: Lancet Infect Dis 2024 PMID: 38710190）
【備考】粉砕，かみ砕き不可
【更新日】20250306

※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。