▼レトロビルカプセル［内］

【重要度】★　【一般製剤名】ジドブジン（アジドチミジン）（U）　Zidovudine（AZT）　【分類】抗HIV薬［ヌクレオシド系NRTI］
【単位】▼100mg/Cap
【常用量】500～600mg/日
【用法】分2～6［他の抗ウイルス薬と併用］
【透析患者への投与方法】1回100mgを1日3回（12,17, Pachon J, et al: Blood Purif 1995 PMID: 8821198）
【その他の報告】1回100mgを6～8hr毎（1）1回200mgを1日3回（Kimmel PL, et al: AIDS 1992 PMID: 1418779）50%に減量し12hrおき（3）
【PD】100mgを8hr毎（12,17）
【CRRT】200mgを8hr毎（17）常用量（12）
【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 10mL/min以上：減量の必要なし，Ccr＜10mL/min：100mgを8hr毎（3,12,17）
【その他の報告】Ccr＜10mL/min：1回100mgを1日3回（Pachon J, et al: Blood Purif 1995 PMID: 8821198）
【特徴】ヒト免疫不全ウイルス感染細胞内で細胞性酵素によりリン酸化され活性型の三リン酸化体（AZTTP）となる．AZTTP はウイルス逆転写酵素を競合的に阻害し，デオキシチミジン三リン酸の代りにウイルスDNA中に取り込まれてDNA鎖伸長を停止することによりウイルスの増殖を阻害する．AZTTPのウイルス逆転写酵素に対する親和性は細胞性DNAポリメラーゼより約100倍強く正常細胞に比し選択性の高い抗ウイルス作用を示す.
【主な副作用・毒性】再生不良性貧血，汎血球減少，うっ血性心不全，乳酸アシドーシス及び脂肪沈着による重度の肝腫大，消化器症状，肝障害，腎障害，筋肉関節障害，不安感，うつ状態，嗄声，血管拡張，爪・皮膚・口腔粘膜の色素沈着，，視覚障害，女性化乳房など
【吸収】吸収率は90%以上と高いが初回通過効果が高い（U,11）高脂肪食により吸収速度と吸収率が低下する
【F】52～75%（11）64±10%（1）初回通過効果を受ける（U）40%が初回通過効果を受ける（1）末期腎不全患者では投与4時間後の血清濃度が腎機能正常者の6倍高い（Kimmel PL, et al: AIDS 1992 PMID: 1418779）63%（13）
【tmax】0.8hr（1）0.5～1.5hr（U,11）0.5～1hr（13）
【代謝】肝で主にグルクロン酸抱合され主代謝物GZDVとなる（1）GZDVの活性はなし（1）5-O-グルクロン酸抱合体が主要代謝物（13）
【排泄】尿中未変化体排泄14%［糸球体濾過と尿細管分泌］，GZDV 74%（1）18%（11,13）8～25%（12）25%（Touchette MA, et al: DICP 1991 PMID: 1763539）代謝物として60～75%が尿中に回収（1）代謝物は腎排泄される（12）
【CL】1.6±0.6L/hr/kg（1）3518±1123mL/min（11）26mL/min/kg，腎障害・肝硬変で低下（13）腎CL0.34 ± 0.05L/hr/kg（1）透析患者で7.33mL/min/kgと腎機能正常者に比し66%低い（Pachon J, et al: AIDS 1992 PMID: 1418779）【非腎CL/総CL】0.79（1）
【t1/2】1.1hr（1）1.1～1.4hr（12）0.78～1.93hr（11）肝障害で延長（1,11,13）肝硬変2.4hr（U）細胞内3リン酸化体3.3hr（U）
【腎不全患者のt1/2】Ccr 18ml/min：1.4hr（1）Ccr 30ml/min：1.4～2.9hr（U）1.4～3hr（12）透析患者で2.9hrと正常腎機能者の3倍に延長（Deray G, et al: Therapie 1989 PMID: 2623654）3.2hr（Pachon J, et al: AIDS 1992 PMID: 1418779）
【蛋白結合率】34～38%でアルブミンと結合（1,11）25%以下（13）10～30%（12）透析患者10%以下（Gallicano KD, et al: J Acquir Immune Defic Syndr 1992 PMID: 1740749）
【Vd】1.6L/kg（1,11）1.4～3L/kg（12）BBBを通過し，脳脊髄液移行率は血清濃度の24%（U）1.4～1.7 L/kg（U）1.4L/kg，腎障害・肝硬変で低下（13）

【MW】267.24
【透析性】ほとんど除去されない（1）
【透析CL】未変化体102mL/min，GZDV 71mL/min（Deray G, et al: Therapie 1989 PMID: 2623654）
PDでは透析液に0.6%しか回収されず，クリアランス4.3～5.9mL/min（Gallicano KD, et al: J Acquir Immune Defic Syndr1992 PMID: 1740749）
【TDMのポイント】血清濃度やクリアランスの個人差が大きくTDMは有用と思われる（Cox S, et al: J Virol Methods 30: 89-98,1990）【O/W係数】1.15［1-オクタノール/水系］（1）1.0（11）【pKa】9.68（1）
【相互作用】血友病患者ではイブプロフェンと併用禁忌（出血傾向増強）（1）
腎毒性の増強，グルクロン酸抱合への影響，薬理作用への影響などの相互作用が報告（1）

【更新日】20250524

※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。