

▼エビビル錠 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】ラミブジン (U) Lamivudine (3TC) 【分類】抗HIV薬 [NRTI・スクレオシド系]

【単位】▼150mg・▼300mg/錠

【常用量】300mg/日 [他の抗HIV薬と併用]

【用法】1日1~2回

【透析患者への投与方法】設定されていない (1)

【その他の報告】1日1回25mgで健常人の300mg/日相当 (Bohjanen PR, et al: Antimicrob Agents Chemother 46: 2387-92, 2002)
25mg/日もしくは75mg隔日 [HD日はHD後] (17)

【PD】10mg/日 (17) 25~50mgを24hr毎 (サンフォード感染症治療ガイド,12)

【CRRT】150mg/日 (17) 初日100mg, 以後50mg/日 (サンフォード感染症治療ガイド,12)

【保存期CKD患者への投与方法】抗HIVに対する用量として, Ccr 50mL/min以上: 300mg/日を分1または分2, Ccr 30~49mL/min: 150mgを1日1回, Ccr 15~29mL/min: 初回150mg, その後100mgを1日1回, Ccr 5~14mL/min: 初回150mg, その後50mgを1日1回, Ccr 5mL/min未満: 初回50mg, その後25mgを1日1回 (1) 【その他の報告】GFR>50mL/min: 150mgを12hr毎もしくは300mgを24hr毎. GFR 10~50mL/min: 150mgを24hr毎, GFR 10mL/min未満: 20mgを24hr毎 (17)

Ccr>50mL/min: 300mgを24hr毎, Ccr 10~50mL/min: 50~150mgを24hr毎, Ccr 10mL/min未満: 25~50mgを24hr毎 (サンフォード感染症治療ガイド,12)
軽度腎障害患者には200mg/日に減量 (Bouazza N, et al: Br J Clin Pharmacol 78: 847-54, 2014)

Ccr 50~70: 200mg/24hr (Wen H, et al: Expert Rev Clin Pharmacol 2022 PMID: 35938476)

【特徴】細胞内でリン酸化されHIV感染細胞内での半減期が約12時間の5'-トリリン酸化体に変換され, HIVの逆転写酵素によりウイルスDNA鎖に取り込まれDNA鎖の伸長を停止することによりHIVの複製を阻害する. トリリン酸化体はHIVの逆転写酵素を競合的に阻害する.

【主な副作用・毒性】頭痛, 倦怠感, 不眠, めまい, 食欲不振, 吐き気, 腹痛, 下痢, 発疹・じんま疹・かゆみ, 気持ちが悪くなる, 不安感, 筋肉痛など

【モニターすべき項目】

【吸収】食事の影響を受けない (1)

【F】82% (1)

【Tmax】0.5~2hr (U) 空腹時1hr, 食後投与で3.2hr (U)

【代謝】代謝物のトランス-スルホキシド体には抗HIV活性なし (1) トランス-スルホキシド体のみが主代謝物であるが, 血中濃度は不明 (U) 活性代謝物の5'-triphosphate anaboliteあり. 代謝にCYPは関与していない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率73% (1) 70~80% (12) 49~85% (13) 主代謝物であるトランス-スルホキシド体の尿中排泄率5% (1) 尿中への排出は速やかであり, 48時間までに投与量の約70%が排泄され, 7日間における尿中ならびに糞中累積排泄率はそれぞれ投与量の74%及び17%に相当. 糸球体濾過に加えて尿細管分泌も関与 (U) 錠剤を経口投与後の尿中未変化体排泄率が70%でFが82%であるため, 尿中未変化体排泄率は85% (Johnson MA, et al: Clin Pharmacokinetics 36: 41-66,1999)

【CL】399mL/min [iv] (1) 4.95mL/min/kg, 腎障害で低下 (13) 20~25/hr, 約0.3L/hr/kg (Johnson MA, et al: Clin Pharmacokinetics 36: 41-66,1999) 【非腎CL/総CL】039 (1)

【t1/2】6.5~9.3hr (1) 5~11hr (12) 2.6 hr, 細胞内におけるリン酸化体 11~15hr (U) 9.11hr, 腎障害で延長 (13) In vitroではHIVおよびHBVの寄生している細胞中でのt1/2は各々10.5~15.5hr, 17~19hr (Johnson MA, et al: Clin Pharmacokinetics 36: 41-66,1999) 【腎不全患者のt1/2】Ccr 10~40 mL/min: 13.6hr, Ccr 10mL/min以下のとき19.4 hr (1,U) 非透析時17.2hr, 透析時5.3hr (Bohjanen PR, et al: Antimicrob Agent Chemother 46: 2387-92, 2002) Ccr<20 mL/min: 14.8hr (1) Ccr 10~40 mL/min: 約13.6hr, Ccr 10mL/min以下: 19.4 hr (U) 20hr (12)

【蛋白結合率】36%以下 (1,13) 36%, 活性体では3%以下 (U) 36%以下, 腎障害で低下 (13) 36% (12)

【Vd】1.3L/kg (1,13) 25.6±6.22L/man [iv] (U) 0.8~1.3L/kg (12)

【分布】血液脳関門, 胎盤を通過する (U) 脳脊髄液濃度は血漿濃度の4~8% (Johnson MA, et al: Clin Pharmacokinetics 36: 41-66,1999)

【MW】410.40

【透析性】透析による抽出率は50%であるがVdが100L/manと大きいので4時間透析では効率的には除去されない (Johnson MA, et al: Br J Clin Pharmacol 46: 21-7,1998) 【透析CL】106mL/min, 透析抽出率52.8%, HDによるAUCの減少率は24% (1) 138mL/min (Bohjanen PR, et al: Antimicrob Agents Chemother 46: 2387-92, 2002) 【透析時t1/2】5.3hr (Bohjanen PR, et al: Antimicrob Agents Chemother 46: 2387-92, 2002)

【OW係数】0.40 [1-オクタノール水系] (1) 【pKa】4.3

【相互作用】ジドブジン (レトロビル) の併用投与を行ったとき, ジドブジンの最高血中濃度が28%上昇したが, ラミブジン, ジドブジンのAUCに有意な変化なし (1)

【効果発現】

【効果持続】

【備考】他の抗HIV薬と必ず併用すること

【更新日】20231021

※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。