

## ▼ピラセプト錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ネルフィナビルメシル酸塩 (U) nelfinavir mesilate (NFV)

【分類】 抗 HIV 薬 [PI]

【単位】 ▼250mg/錠

【常用量】 1回 1250mg を 1日 2回, または 1回 750mg を 1日 3回

【用法】 分 2~3 [他の抗 HIV 薬と併用]

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (サンフォード感染症治療ガイド)

【その他の報告】 データなし (3)

【PD】 データなし (12)

【CRRT】 減量の必要なし (12)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (12,サンフォード感染症治療ガイド) 【その他の報告】 データなし (3)

【特徴】 HIV-1 由来のプロテアーゼ活性を選択的に阻害する。逆転写酵素阻害剤との併用で用いられる。

【主な副作用・毒性】 下痢、嘔気、腹部膨満感、後天性リポジストロフィー、頭痛、脱力感、腹痛、発疹、搔痒感、糖尿病、血糖値の上昇、出血傾向など

【吸収】 食後投与の Cmax や AUC は空腹時の 2~3 倍 (U)

【F】 空腹時に投与すると食後投与よりも 50%低下する (1) 80% (1)

【tmax】 2~4hr (U)

【代謝】 CYP3A4 を含むいくつかの酵素で代謝され、主代謝物は未変化体と同等の抗ウイルス活性を有する (U) t-ブチル基の水酸化物 (M8) の抗ウイルス活性は未変化体と同程度 (1) CYP3A4 と CYP2C19 が関与 (1)

【排泄】 主に糞中回収され、尿中未変化体排泄率 0.2%以下 [24hr まで] (1) 1~2% (U) 2%未満 (12) 87%が糞便中に排泄され、そのうち未変化体は 22% (U) 【血漿 CL】 16L/hr (1)

【t1/2】 2~5hr (1) 3.5~5.5hr (12) 3.5~5hr (U) 【ESRD 患者の t1/2】 データなし (12)

【蛋白結合率】 98%以上 (12,U) 98.7~99.3% (1)

【Vd】 2~7L/kg (12,U) 資料なし (1)

【MW】 663.89

【透析性】 透析で除去されにくいと思われる (5) 資料なし (1)

【O/W 係数】  $\text{LogP}=4.07\pm 0.2$  [1-オクタノール/水系] (1) 【薬物動態】 750mg×3/日投与時の定常状態の濃度は 3~4mg/L (U) 【TDM のポイント】 TDM の対象にならない。トラフ濃度と有害事象は関連がみられない (1)

【相互作用】 トリアゾラム、ミダゾラム、アルプラゾラム、ピモジド、麦角誘導体、アミオダロン、硫酸キニジン、エレトリプタン、エプレレノンの代謝を抑制するため併用禁忌 (1) リファンピシンとの併用により本剤の血中濃度が 20~30%低下するため併用禁忌 [リファンピシン投与後は少なくとも 2 週間の間隔をおくことが望ましい] (1) オメプラゾールにより吸収が抑制され AUC が低下するため併用すべきではない (Fang AF, et al: Pharmacotherapy 28: 42-50, 2008)

【更新日】 20180409

※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。