○バラクルード錠　［内］

【重要度】★★★　【一般製剤名】エンテカビル 水和物（U）　Entecavir Hydrate（ETV）　【分類】抗ウイルス化学療法剤［B 型肝炎］
【単位】○0.5mg/錠
【常用量】1 日 1 回 0.5mg［ラミブジン不応患者には 1mg/日 ］
【用法】1 日 1 回 空腹時 投与［食後 2 時間以降かつ次の食事の 2 時間以上前］
【透析患者への投与方法】0.5mg を 7 日に 1 回（U）HD 例には HD 後の空腹時投与（1）
【その他の報告】腎機能正常患者と比べて透析患者において特徴的な副作用は特定されていない（1）
0.5mg を 5～7 日毎（17）
HD 患者に適用した症例（Spaziante M, et al: J Med Virol 2014 PMID: 24136393）
【PD】0.5mg を週 1 回投与が適用可能と思われる（加藤章浩, 他: 透析会誌 45:S964,2012）
【保存期 CKD 患者への投与方法】それぞれ 1 回 0.5mg（ラミブジン不応患者には 1mg）を，Ccr 30～50mL/min 未満：2 日に 1 回，Ccr 10～30mL/min 未満：3 日に 1 回，Ccr 10mL/min 未満：7 日に 1 回（1）
【その他の報告】GFR＞50mL/min：0.5mg/日，GFR 30～50mL/min：0.25mg/日か 0.5mg を 48hr 毎，GFR 10～29mL/min：0.15mg/日か 0.5mg を 72hr 毎（17）
ラミブジン不応例には GFR＞50mL/min：1mg/日，GFR 30～50mL/min：0.5mg/日，GFR 10～29mL/min：0.3mg/日か 0.5mg を 48hr 毎（17）
いずれの腎機能レベルでも腎障害の原因にならない（Suzuki K, et al: Hepatol Res 2019 PMID: 31260579）
【特徴】B 型肝炎ウイルスの増殖を伴い肝機能の異常が確認された B 型慢性肝疾患における B 型肝炎ウイルスの増殖抑制に適用される．グアノシンと類似したヌクレオシド誘導体 HBV の DNA ポリメラーゼを阻害する．HIV 感染者では使用できない．
【主な副作用・毒性】アナフィラキシー，乳酸アシドーシス，倦怠感，脂肪肝，消化器障害，肝障害，過敏症，頭痛，めまい，下痢，鼻咽頭炎など
【吸収】食事により吸収率低下［AUC20%低下］（1）食事により AUC が 22%低下するので空腹時投与がよい（Zhang QH, et al: Arzneimittelforschung 60: 640-4, 2010 PMID: 21125816）食後投与によってもウイルス学的有効性は低下しない（Cho EJ, et al: Drug Des Devel Ther 2018 PMID: 30464407）
【F】100%（U）70%以上［液剤］（1）
【tmax】1～1.5hr（U）0.5～1.5hr（1）
【代謝】代謝物は同定されていないが，グルクロン酸抱合体，硫酸抱合体は存在する（1,U）CYP 酵素への影響はない（1,U）
【排泄】尿中未変化体排泄率 78～80%（1）62～73%（U, Yan JH, et al: J Clin Pharmacol 46: 1250-8, 2006 PMID: 17050790）尿細管分泌も関与する（1,U）OAT2 の基質（Furihata T, et al: Drug Metab Pharmacokinet 2017 PMID: 27916488）
OAT1/3 と OAT2 により尿細管細胞に取り込まれ, MATEs, MDR1, MRP2 により分泌され, OCTN1/2 は分泌と再吸収に関与すると思われる（Yang X, et al: Antimicrob Agents Chemother 2016 PMID: 27503646）
【CL/F】588mL/min（1）腎 CL=505mL/min（1）26.4L/hr（Yoshitsugu H, et al: Diagn Microbiol Infect Dis 70: 91-100, 2011 PMID: 21513847）
【t1/2】128～149hr（U）83.3～96.9hr（1）
【蛋白結合率】13%（1,U）
【Vd】大きい（U）Vd/F=2466L/man（1）
【MW】295.3
【透析性】Vd が大きいため透析されにくいと思われる（5）HD で投与量の約 13%，CAPD で投与量の約 0.3%が除去（1）
【TDM のポイント】エンテカビル血中濃度とウイルス学的効果は必ずしも相関せず（Boglione L, et al: Int J Antimicrob Agents 2016 PMID: 27444118）
【O/W 係数】0.15［1-オクタノール/buffer，pH7.1］（1）
【相互作用】
【更新日】20241012

※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。