

▼ピレスノ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ピルフェニドン Pirfenidone 【分類】特発性肺線維症治療薬

【単位】▼200mg/錠

【常用量】初期量：1回200mgを1日3回（1日600mg）[増量は1回量を200mgずつ、最大1回600mg（1日1800mg）まで]

【用法】分3食後

【透析患者への投与方法】減量の必要はないと思われる（5）が、使用経験が少ないため慎重投与（1）

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要はないと思われる（5）が、使用経験が少ないため慎重投与（1）

【特徴】炎症性サイトカイン（TNF- α 、IL-1、IL-6等）の産生抑制と抗炎症性サイトカイン（IL-10）の産生亢進を示し、Th2型への偏りの改善（Th1・Th2バランスの修正）につながるIFN- γ レベルの低下の抑制を示し、線維化形成に関与する増殖因子（TGF- β 1、b-FGF、PDGF）の産生抑制を示すなどの各種サイトカイン及び増殖因子に対する産生調節作用を有する。線維芽細胞増殖抑制作用やコラーゲン産生抑制作用も有し、これらの複合的な作用に基づき抗線維化作用を示すと考えられる

【主な副作用・毒性】光線過敏症、皮膚発がん、肝障害、消化器症状など

【安全性に関する情報】皮膚の発がんの可能性があると説明する（1）

【吸収】ka：6.8±6.9/hr（1）

【F】データなし（1）食事により吸収率が低下するが、Cmaxが食欲不振、光線過敏、 γ -GTの上昇に関連する可能性があるため、Cmaxの低下する食後に服用する（1, Shi S, et al: J Clin Pharmacol 47: 1268-76, 2007, Rubino CM, et al: Pulm Pharmacol Ther 22: 279-85, 2009）

【tmax】0.6~0.8hr（1）0.33~1hr（Shi S, et al: J Clin Pharmacol 47: 1268-76, 2007）1.8~2.2hr [食後]、カルボン酸体として1.5~2.2hr（Huang NY, et al: Drug Res (Stuttg). 63: 388-95, 2013）

【代謝】主にCYP1A2により代謝。5-メチル基が酸化的に代謝され、ヒドロキシメチル体からさらにカルボン酸体に変換される（1）複数のCYP（1A2、2C9、2C19、2D6、2E1）が関与して代謝され、未変化体および代謝物はCYPを阻害しない（1）主にCYP1A2で水酸化（Zhang Y, et al: Xenobiotica 2021 PMID: 34779706）

【排泄】尿中未変化体排泄率1%未満 [48hrまで]（1）0.6%（Huang NY, et al: Drug Res (Stuttg) 63: 388-95, 2013）主代謝物のピルフェニドン-5-カルボン酸体として90%が尿中に排泄される [48hrまで]（1）尿中に5-カルボン酸体として87.7%尿中に回収（Huang NY, et al: Drug Res (Stuttg). 63: 388-95, 2013）

【CL】資料なし（1）計算上CL/F=14~16L/hr（5）

【t1/2】1.8~2.1hr（1）2~2.5hr、カルボン酸体として2.1~2.6hr（Shi S, et al: J Clin Pharmacol 47: 1268-76, 2007）2.1~2.4hr（Huang NY, et al: Drug Res (Stuttg) 63: 388-95, 2013）【ke】0.28±0.16/hr（1）

【蛋白結合率】54~62%（1）

【Vd/F】55±13L/man（1）

【MW】185.22

【透析性】透析性はあるが、除去率は高くないと思われる（5）資料なし（1）

【O/W係数】有機相に分配（1）【薬物動態】600mgまで線形でPKに性差なし（Huang NY, et al: Drug Res (Stuttg). 63: 388-95, 2013）

【相互作用】シプロフロキサシン（CYP1A2を阻害）との併用で本剤のAUCが1.8に増加するため併用注意（1）

【主な臨床報告】腎線維化疾患に関するレビュー（Cho ME, et al: Expert Opin Investig Drugs 2010 PMID: 20050822）

52週時点の努力性肺活量（FVC）減少を抑制（King TE Jr, et al: N Engl J Med 2014 PMID: 24836312）

死亡率の相対リスクを減少 [対プラセボ、120週]（Nathan SD, et al: Lancet Respir Med 2017 PMID: 27876247）

呼吸器系入院リスク、入院後死亡リスク低下（Ley B, et al: Am J Respir Crit Care Med 2017 PMID: 28471697）

腎線維化を抑制する可能性（Bai X, et al: Eur J Pharmacol 2021 PMID: 34547247）

【更新日】20230515

※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。