

▼レクシヴァ錠 [内] <2024.3 販売中止>

【重要度】 【一般製剤名】ホスアンブレナビル カルシウム 水和物 fosamprenavir calcium hydrate (FPV) 【分類】抗HIV薬 [PI]

【単位】▼700mg/錠

【常用量】1回700~1400mg [リトナビルの併用により異なる]

【用法】併用薬 [リトナビル] により1日1~2回 (添付文書参照)

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (1, サンフォード感染症治療ガイド)

【その他の報告】HD タイミングにかかわらず投与できる (Janus N, et al: Med Mal Infect 37: 832-4, 2007 PMID: 17997253 [abstract])

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (1, サンフォード感染症治療ガイド)

【特徴】アンブレナビルのプロドラッグで、消化管上皮から吸収される過程でアンブレナビルに変換される。アンブレナビルは、前駆体ポリ蛋白質の解裂に関与する HIV プロテアーゼを阻害することで感染性を持つウイルスの産生を抑制する。ジダノシン、ジドブジン、アバカビル等のヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤 (NRTI) あるいはサキナビルと併用することにより抗ウイルス活性において相乗作用を示し、インジナビル、リトナビルあるいはネルフィナビルと併用することにより相加作用を示す。

【主な副作用・毒性】SJS, 高血糖, 出血傾向, 横紋筋融解症, 筋肉痛, 皮膚障害, 消化器症状, 腎結石, 疲労など

【F】リトナビルとの併用により吸収率が約1.6倍上昇 (1)

【tmax】2~3hr (1) 1.5~2hr (Wire MB, et al: Clin Pharmacokinetics 45: 137-68, 2006 PMID: 16485915)

【代謝】主に消化管上皮において速やかにアンブレナビルと無機リン酸に加水分解され、アンブレナビルは、主に肝臓において CYP3A4 により代謝される (1) リトナビル併用時にはリトナビルの強力な CYP3A4 阻害により、アンブレナビルの代謝が阻害され、血漿中アンブレナビル濃度が上昇する (1) ただし、併用投与で使用されるリトナビルの用量はリトナビルの通常臨床用量の6分の1であり、併用時の抗ウイルス活性は主にアンブレナビルによるものである (1) CYP3A4 を阻害する (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率1%未満 [po] (1, Wire MB, et al: Clin Pharmacokinetics 45: 137-68, 2006 PMID: 16485915) 尿中回収率14% [po] (1) 尿中回収率14%, 糞便中回収率75% [ほぼ2種の代謝物] (Sadler BM, et al: J Clin Pharmacol 41: 386-96, 2001 PMID: 11304895)

【t1/2】8.5hr (1) リトナビル併用時12hr (1)

【蛋白結合率】約90% (1) AAG と結合し、AAG 濃度により CL/F が変動 (Sadler BM, et al: Antimicrob Agents Chemother 45: 852-6, 2001 PMID: 11181371)

【Vd/F】600L/man, リトナビル併用時360L/man (1) P-gp の基質であるため脳内移行が制限されている (Polli JW, et al: Pharm Res 16: 1206-12, 1999 PMID: 10468021)

【MW】623.67 [無水物]

【透析性】低いと思われる (5)

【O/W 係数】資料なし (1)

【相互作用】クラリスロマイシン併用によりアンブレナビルの AUC が18%増大するが、用量調節を必要とする程度ではない (Brophy DE, et al: Antimicrob Agents Chemother 44: 978-84, 2000 PMID: 10722500) 治療域の狭い CYP3A4 の基質薬物と併用禁忌 (1) バルデナフィルと併用禁忌 (1) リファンピシン, リファブチンによる血中濃度低下 (Polk RE, et al: Antimicrob Agents Chemother 45: 502-8, 2001 PMID: 11158747)

イブuprofen, エベロリムスの血中濃度上昇の可能性 (1)

【肝障害患者における情報】肝機能障害の程度により減量を推奨 (Veronese L, et al: Antimicrob Agents Chemother 44: 821-6, 2000 PMID: 10722476)

【更新日】20230706

※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。