▼ビリアード錠　［内］

【重要度】★★　【一般製剤名】テノホビル ジソプロキシル フマル酸塩（U）　Tenofovir Disoproxil Fumarate（TDF）　【分類】抗HIV薬［ヌクレオチド系NRTI］
【単位】▼300mg/錠［テノホビル ジソプロキシルとして245mg］
【常用量】1回300mgを1日1回
【用法】1日1回［他の抗HIV薬と併用］
【透析患者への投与方法】1回1錠，週1回（1）または累積約12時間の透析終了後に1錠投与（1,17）
【その他の報告】避ける（12）
【PD】データなし（17）避ける（12）
【CRRT】データなし（17）避ける（12）
【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 30～49mL/min：1回1錠2日に1回，Ccr 10～29mL/min：1回1錠，1週間に2回，Ccr 10mL/min未満：検討されていない（1）
【その他の報告】GFR＞50mL/min：減量の必要なし，GFR 30～50mL/min：できれば避けるが，必要なら300mgを48hr毎，GFR 10～29mL/min：できれば避けるが，必要なら300mgを72～96hr毎，GFR 10mL/min未満：データなし（17）
GFRの低下はAUC増大に関連（Baxi SM, et al: AIDS 28: 59-66, 2014）
GFR 50mL/min以下では投与を避ける（12）
【特徴】テノホビルの経口プロドラッグ．体内でヌクレオチド系化合物であるテノホビルに代謝され，細胞内に取り込まれた後に活性型のテノホビル二リン酸に代謝されHIV-1 逆転写酵素を阻害.
【主な副作用・毒性】腎不全，腎機能障害，膵炎，乳酸アシドーシス，消化器症状，倦怠感，無力症，頭痛，高脂血症，骨障害，筋肉痛，気管支炎など
【安全性に関する情報】投与前に腎機能検査［Ccr，尿糖，尿蛋白］を実施し，投与後も腎機能を観察する．また腎機能障害のリスクを有する患者には血清リンを測定する．腎毒性を有する薬剤との併用は避けることが望ましい（1）骨代謝回転の亢進に関連（1）尿細管MRP4の作用低下が尿細管障害に関連している可能性［マウス］（Kohler JJ, et al: Lab Invest 91: 852-8, 2011）ABCC2遺伝子塩基多型が尿細管障害に関連している可能性（Rodriguez-Novoa S, et al: Clin Infect Dis 48: e108-16, 2009 PMID: 19400747）
【吸収】高脂肪食でCmax上昇（U）
【F】25%［空腹時］（1,U）
【tmax】2～3hr（1）1±0.4hr（1）
【代謝】ジエステル化プロドラッグであり活性体はテノホビル（1）テノホビルが細胞内でテノホビル二リン酸に代謝されて活性体となる（1）
【排泄】尿中未変化体排泄率30%［po，24hrまで］70～80%［iv．72hrまで］（1,12,U）糸球体濾過と尿細管分泌により排泄（1,U）【CL】400mL/min［単回投与試験からの計算値］（5）腎CL 250mL/min（1）
【t1/2】15hr（1）17hr（U）8～12hr（12）
【蛋白結合率】0.7%（1）0.7%未満（U）7%（12）
【Vd】1.3L/kg（1）1.2～1.3L/kg（U,12）
【MW】635.51
【透析性】透析膜抽出率54%，4hrHDでの除去率10%（1,U）膜は通過するが，Vdが大きいため効率的ではない（5）
【O/W係数】1.25［1-オクタノール/リン酸buffer，pH6.5］（1）
【相互作用】レジパスビル／ソホスブビルによりテノホビルの血中濃度上昇（1）
【主な臨床報告】TDF，3TCの長期投与時のHIV，HBVに対するPK評価（Lartey M, et al: AIDS 2023 PMID: 37861682）
【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。