▼ストックリン錠　［内］＜2024.3 販売中止＞

【重要度】　【一般製剤名】エファビレンツ（U）　Efavirenz　【分類】抗 HIV 薬［NNRTI］
【単位】▼600mg/錠
【常用量】600mg/日
【用法】1 日 1 回［精神神経系症状の副作用対策のため就寝前の投与が推奨］
【透析患者への投与方法】減量の必要なし（1,12,サンフォード感染症治療ガイド）
【PD】減量の必要なし（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（1,12,サンフォード感染症治療ガイド）
【特徴】NNRTI で逆転写酵素の基質結合部位近傍に結合し，逆転写酵素活性を非競合的に阻害する．
【主な副作用・毒性】SJS，多形紅斑，肝障害，体脂肪の再分布/蓄積，頭痛，倦怠感，ほてり，消化器症状，動悸，関節痛，感覚鈍麻，中枢神経症状，体重減少など多数
【吸収】高脂肪食で F が上昇する可能性（1，抗 HIV 薬治療ガイドライン 2012）ka=0.3/hr（Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140）
【F】資料なし（抗 HIV 薬治療ガイドライン 2012）個体間変動は大きいが個体内変動は小さい（Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140）
【tmax】4hr（1）
【代謝】CYP2B6，3A4 で代謝され，3A4 を誘導，阻害する（1，抗 HIV 薬治療ガイドライン 2012）代謝物は 7-水酸化体，8-水酸化体で活性はなく，これらはグルクロン酸抱合，グルタチオン抱合，硫酸抱合，システニルグリシン抱合を受ける（1）CYP3A4，2B6 の誘導剤である（1）水酸化されさらに抱合される（U）
【排泄】尿中回収率 0.01%以下［po，24hr まで］（1）尿中未変化体排泄率 1%未満（12）尿中に代謝物として 14～34%回収（U）
【CL】0.68L/hr/kg［iv，サル］（1）CL/F=9.4L/hr（Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140）
【t1/2】78hr（1）40～75hr（12）単回 52～76hr，反復 40～55hr（U）
【蛋白結合率】99%以上（1,12）99.5%［Alb］（U）
【Vd】資料なし（1）252L/man（Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140）4L/kg（12）
【MW】315.67
【透析性】除去されないと思われる（1）
【O/W 係数】LogP＝5.4［1-オクタノール/水系］(1)【TDM のポイント】有効治療域 1～4ng/mL（Csajka C, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 20-30, 2003 PMID: 12545140）
【相互作用】CYP2C19 や 3A4 の誘導作用がある（Michaud V, et al: Clin Pharmacol Ther 91: 475-82, 2012）CYP）3A4，2B6，P-gp の誘導剤（1）多種の薬物間相互作用がある（12）
【更新日】20240425

※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。