

△スンベプラカプセル [内] <2021.3 販売中止>

【重要度】 【一般製剤名】 アスナプレビル asunaprevir 【分類】 抗ウイルス薬 [HCV-PI]

【単位】 △100mg/cap

【常用量】 1回 100mg, 1日 2回

【用法】 1日 2回 [24週間]

【透析患者への投与方法】ダクラタスビルと共に常用量で適用して SVR12 は 95.5%, 主な副作用は鼻咽頭炎, 貧血, ALT 上昇 (Suda G, et al: J Gastroenterol 51: 733-40, 2016 PMID: 26768604)

【その他の報告】設定されていないが血中濃度からは減量の必要なし (5) ダクラタスビルと併用して SVR12 が 100% (Toyoda H, et al: J Gastroenterol 51: 741-7, 2016 PMID: 26872889)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 PK に変化なく減量の必要なし (Garimella T, et al: Hepatology 58: 430A, 2013)

【その他の報告】設定されていない (1)

腎障害患者でも血中濃度に変化はなく, 有効性・安全性も変わらない (Nakamura Y, et al: J Med Virol 89: 665-671, 2017 PMID: 27602542)

【特徴】 NS3/4A プロテアーゼ阻害剤. セログループ 1 (ジェノタイプ 1) の C 型慢性肝炎または C 型代償性肝硬変で, IFN 不適格・不適用・無効の例に, ダクラタスビル (ダクルインザ) と併用して適用される.

【主な副作用・毒性】 肝機能障害, 頭痛, 発熱, 皮膚障害, 好酸球増多, 血小板減少, 不眠, 下痢, 便秘, 悪心, 口内炎, 高血圧, 関節痛, 鼻咽頭炎, AKI など

【吸収】 小腸上部で吸収 (1)

【F】 初回通過効果を受け, 9.3% (1)

【tmax】 3~4hr (1) 2~4hr (Gentile I, et al: Ther Clin Risk Manag 10: 493-504, 2014)

【代謝】 主に CYP3A4, 3A5 で代謝, 一部 2A6, 2B6, 2C9, 2C19, 2D6 が関与 (1) 酸化, 脱アルキル化, グルタチオン抱合を受ける (1) 代謝物の活性は低い (1) 中等度~高度肝機能障害を有する例への投与は避ける [軽度肝障害患者には減量の必要なし] (Eley T, et al: Antivir Ther 2014)

【排泄】 尿中回収率 0.24% [po, 240hr まで] (1) OATP1B1・2B1 により肝取り込みされる (1)

【CL】 49.5L/hr [iv] (1) CL/F=302~491L/hr (Gentile I, et al: Ther Clin Risk Manag 10: 493-504, 2014)

【t1/2】 15~20hr (1, Gentile I, et al: Ther Clin Risk Manag 10: 493-504, 2014)

【蛋白結合率】 99.8% (1)

【Vd】 194L/man [iv] (1)

【MW】 748.29

【透析性】 資料なし (1) 低いと思われる (5)

【薬物動態】 中等度~重度肝機能障害患者では AUC が著明に上昇 [6~49 倍] するため投与は避ける (Eley T, et al: Antivir Ther 2014)

【O/W 係数】 LogD=5.09 [1-オクタノール/水系, pH6.5] (1)

【相互作用】 CYP2D6, OATP1B1, 1B3, 2B1, P-gp の弱い阻害剤 (1) エシタロプラム, セルトラリンとの相互作用を認めない (Garimella T, et al: Hepatology 58: 445A-446A, 2013) アゾール系抗真菌剤, クラリスロマイシン, エリスロマイシン, ジルチアゼム, ベラパミル塩酸塩, コピシスタット含有製剤, HIV プロテアーゼ阻害剤, リファンピシン, リファブチン, フェニトイン, カルバマゼピン, フェノバルビタール, デキサメタゾン全身投与, モダフィニル, 非スクレオシド系逆転写酵素阻害剤 (リルピビルン塩酸塩を除く), ポセンタン水和物, SJW 含有食品, シクロスポリン, フレカイニド, プロパフェノンとの併用禁忌 (1) CYP2D6 の基質薬物 (デキストロメトルフアン, メトプロロールなど) の血中濃度上昇の可能性 (1)

【主な臨床報告】 高齢者でも有効性・安全性に問題なし (Morio R, et al: J Gastroenterol. 2016 PMID:27631593)

【備考】 副作用で継続できない場合は, ダクラタスビルも中止する (1)

【更新日】 20210403

※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。