

○レパバーサ皮下注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 エボロクマブ Evolocumab 【分類】 脂質異常症治療薬 [抗PCSK9抗体]

【単位】 ▼140mg/syr・○140mg 皮下注ペン [1mL]

【常用量】 ■家族性高コレステロール血症ヘテロ接合体及び高コレステロール血症：140mgを2週間に1回又は420mgを4週間に1回皮下注

■家族性高コレステロール血症ホモ接合体：420mgを4週間に1回皮下注 [最大420mgを2週間に1回]

●LDLアフェレーシスの補助：開始用量として420mgを2週間に1回が選択可

【用法】 2～4週間毎に皮下注■スタチンと併用する（ただしスタチンが適用できない場合は単独投与可）

■投与前30分程度、遮光した状態で室温に戻してから投与

【透析患者への投与方法】 おそらく減量の必要なし (5)

【保存期CKD患者への投与方法】 おそらく減量の必要なし (5)

【その他の報告】 腎障害患者ではAUCが低下するもののLDL-C低下効果は減弱しない (1)

【特徴】 ヒトIgG2モノクローナル抗体で、ヒトプロタンパク質転換酵素サブチリシン/ケキシン9型(PCSK9)を阻害し、肝のLDL受容体の破壊を抑制する。心血管イベントの発現リスクが高く、スタチンで効果不十分な、家族性高コレステロール血症、高コレステロール血症に適用。IgG2型。

【主な副作用・毒性】 貧血、心筋虚血、動悸、消化器症状、注射部位反応、倦怠感、肝酵素異常、糖尿病、筋肉痛、関節痛、感覚鈍麻、不眠、女性化乳房、上気道感染、皮膚症状など

【安全性に関する情報】 主な副作用は鼻咽頭炎、注射部位異常、関節痛、腰痛 (Cicero AF, et al: Expert Opin Biol Ther 14: 863-8, 2014 PMID: 24661068)

【F】 72% (1) 50～100% (Giunzioni I, et al: Vasc Health Risk Manag 2015 PMID: 26345307)

【tmax】 皮下投与にてゆっくり吸収されtmax2～8日 (Giunzioni I, et al: Vasc Health Risk Manag 2015 PMID: 26345307) 3～6.5日 (1)

【代謝】 エンドソーム、リソソームで分解 (Giunzioni I, et al: Vasc Health Risk Manag 2015 PMID: 26345307) 異化作用によりペプチドあるいはアミノ酸へと分解されると推測 (1)

【排泄】 未変化体は尿中に排泄されない (1)

【CL】 11.6±2.26mL/hr [iv] (1)

【t1/2】 61hr [animal model] (Giunzioni I, et al: Vasc Health Risk Manag 2015 PMID: 26345307)

【蛋白結合率】 資料なし (1)

【Vd】 3.3±.5L/man (1)

【MW】 約144,000

【透析性】 透析されないとされる (5) 資料なし (1)

【薬物動態】 線形動態 (1)

【O/W係数】 該当しない (1)

【肝障害患者における情報】 肝障害患者ではAUCが低下するもののLDL-C低下効果は減弱しない (1)

【主な臨床報告】家族性高コレステロール血症患者やLp(a)上昇例において有用である可能性があるが、長期的安全性の検証が必要 (Page MM, et al: Expert Opin Drug Metab Toxicol 2015 PMID: 26293511) PCSK阻害剤のレビュー (Giunzioni I, et al: Vasc Health Risk Manag 2015 PMID: 26345307) スタチンへの追加によりLDL-Cが低下し、心筋梗塞、脳卒中リスクも低下 [ただしNNT大きい] (Sabatine MS, et al: N Engl J Med 2017 PMID: 28304224)

【効果発現時間】 LDL-Cの低下は投与後3日後には認められ、2.5～3週間後に戻る [animal model] (Giunzioni I, et al: Vasc Health Risk Manag 11: 493-501, 2015 PMID: 26345307)

【更新日】 20240626

※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。