

▼ジメンシー配合錠 [内] <販売中止>

【重要度】★ 【一般製剤名】ダクラタスビル塩酸塩/アスナプレビル/ベクラブビル塩酸塩 daclatasvir hydrochloride/asunaprevir/beclabuvir hydrochloride

【分類】抗ウイルス薬 [HCV]

【単位】▼配合錠 [ダクラタスビル 15mg/アスナプレビル 100mg/ベクラブビル 37.5mg]

【常用量】4錠/日 [1回2錠, 1日2回] 投与期間は12週間

【用法】1日2回, 食後

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Cr 50mL/min 未満の非透析患者は (特に) アスナプレビルの血中濃度が上昇するおそれがあるため慎重投与 (1)

【特徴】NS5A 複製複合体阻害剤のダクラタスビル, NS3/4A プロテアーゼ阻害剤のアスナプレビル, NS5B ポリメラーゼに対する非核酸型阻害剤であるベクラブビルの配合剤。患者背景, IL28B 遺伝子型, NS5A 領域 L31 又は Y93 の耐性変異の有無にかかわらず良好な抗ウイルス効果が得られる。

【主な副作用・毒性】肝機能障害, 肝不全, 多形紅斑, 血小板減少, 間質性肺炎, かゆみ, 好酸球増多, 発熱, 倦怠感, 消化器症状など

【安全性に関する情報】

【吸収】アスナプレビルの吸収は食後で増大 (1)

【F】ダクラタスビル 67%, アスナプレビル 9.3%, ベクラブビル 66% (1)

【tmax】ダクラタスビル 1hr, アスナプレビル 4hr, ベクラブビル 4hr (1)

【代謝】ダクラタスビルは主に CYP3A4 で代謝。アスナプレビルは主に CYP3A で代謝, OATP1B1 の基質。ベクラブビル及び BMS-794712 [N-脱メチル化体の活性代謝物] は主に CYP3A4 で代謝。BMS-794712 の AUC は, 未変化体 AUC の 25~30% (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率: ダクラタスビルは 6.6%以下, アスナプレビルはほぼゼロ, ベクラブビルとしてはほぼゼロ (1)

糞便中回収率: ダクラタスビル 88% (未変化体として 53%), アスナプレビル 84% (未変化体として 7.5%), ベクラブビル 89% (未変化体 6.9%) (1)

【CL】ダクラタスビル 4.24L/hr, アスナプレビル 49.5L/hr, ベクラブビル 5.59L/hr [iv] (1)

【t1/2】ダクラタスビル 10hr, アスナプレビル 19hr, ベクラブビル 6hr (1)

【蛋白結合率】それぞれ 99% (1)

【Vss】ダクラタスビル 47L/man, アスナプレビル 194L/man, ベクラブビル 36L/man [それぞれ iv] (1)

【MW】ダクラタスビル 811.80, アスナプレビル 748.29, ベクラブビル 696.30

【透析性】除去されない (1)

【O/W 係数】ダクラタスビル LogP=5.52, アスナプレビル LogP=5.09, ベクラブビル LogP=4.4 [それぞれ 1-オクタノール/buffer, pH6.5] (1)

【相互作用】ダクラタスビルは CYP3A4, P-gp の基質で, P-gp, OATP1B1・1B3, BCRP を阻害する (1) アスナプレビルは CYP3A, P-gp, OATP1B1 の基質で, CYP2D6, OATP1B1・1B3, P-gp の阻害作用および CYP3A4 の誘導作用を有する (1) ベクラブビルは CYP3A, P-gp 及び BCRP の基質で, P-gp, BCRP, OATP1B1・1B3 の阻害作用, CYP3A4 の誘導作用を有する (1) CYP3A4 の阻害剤および誘導剤との併用禁忌 (1)

【小児 CKD 患者における報告】使用経験なし (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦に禁忌, 授乳は中止 (1)

【主な臨床報告】SVR12 は初回治療者で 92%, 治療経験者で 89.3% (Poordad F, et al: JAMA 313: 1728-35, 2015 PMID: 25942723)

【更新日】20200404

※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。