

▼オテズラ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】 アプレミラスト apremilast 【分類】 乾癬治療薬 [PDE4 阻害剤]

【単位】 ▼10mg・▼20mg・▼30mg錠

【常用量】 初日は1日1回朝に10mg, 2日目から10mgを1日2回とし, 3日目の夕から1回20mgに増量, 5日目の夕から1回30mgに増量

■維持量は1回30mg1日2回

■開始時の漸増は消化器症状の防止目的である

【用法】 1日2回, 朝・夕

■治療効果は24週以内に判定

【透析患者への投与方法】 重度の腎障害患者は血中濃度上昇の可能性から慎重投与であり, 1回30mg1日1回朝などに減量 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 Cr 30mL/min 未満: 血中濃度上昇の可能性から慎重投与であり, 1回30mg1日1回朝などに減量 [投与開始時は朝の用量のみ慎重投与] (1) eGFR 30mL/min/1.73m² 未満の重度腎障害患者で AUC が 1.8 倍に上昇 (1)

【特徴】 局所療法 (ステロイド外用剤等) で効果不十分な関節症性乾癬に適用される PDE4 阻害剤。皮疹が体表面積の 10%以上に及ぶ症例, 難治性の皮疹又は関節症状を有する症例に限定して適用。PDE4 は主に炎症性細胞に分布しており, その阻害により cAMP が上昇して炎症性サイトカインの産生を抑制し, 抗炎症効果をもたらすと考えられている。

【主な副作用・毒性】 感染症, 過敏症, 悪心, 嘔吐, 下痢, 頭痛, 鼻咽頭炎, 上気道感染, めまい, 不眠, 疲労など

【安全性に関する情報】 サリドマイドやポマリドミドの化学構造を構成しているフタルイミド基を含む化合物であり, 妊婦には禁忌である (1)

【吸収】 食事の影響を受けない (1)

【F】 73% (1)

【tmax】 2~3hr (1)

【代謝】 CYP3A4 により代謝され主代謝物 O-脱メチル体となり, グルクロン酸抱合体を受ける (1) 加水分解される代謝経路も存在 (1) CYP1A2 や 2A6 も関与する

(1) 主代謝物の薬理活性は未変化体の 1/50 以下 (Hoffmann M, et al: Xenobiotica 41: 1063-75, 2011 PMID: 21859393)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 3% [po] (1) 尿中回収率 58%, 糞便中回収率 39% [po] (1) 排泄物の 34%は O-脱メチル体のグルクロン酸抱合体 (Hoffmann M, et al: Xenobiotica 41: 1063-75, 2011 PMID: 21859393)

【CL/F】 13L/hr [po] (1)

【t1/2】 5~6hr (1)

【蛋白結合率】 68% (1)

【Vd/F】 80~100L/man (1)

【MW】 460.50

【透析性】 いくらかは除去されると思われる (5)

【相互作用】 CYP3A4 誘導剤により血中濃度低下 (1) リファンピシン併用で AUC が 72%低下 (1) ケトコナゾールとの併用で AUC36%上昇 (Liu Y, et al: Br J Clin Pharmacol 78: 1050-7, 2014 PMID: 24962564)

【肝障害患者への投与方法】 PK は肝障害の影響を受けにくい (1)

【小児 CKD 患者における報告】 安全性未確立 (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】 妊婦に禁忌, 授乳は避ける (1)

【備考】 噛み砕かない, 粉碎不可 (1)

【更新日】 20240207

※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。