

▼スマイラフ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ペフィシチニブ臭化水素酸塩 Peficitinib Hydrobromide [ASP015K] 【分類】 関節リウマチ治療薬 [JAK 阻害剤]

【単位】 ▼50mg・▼100mg/錠

【常用量】 150mg/日 [状態により 100mg/日]

■中等度の肝障害：50mg/日

【用法】 1日1回（食後）

【透析患者への投与方法】 常用量（1）

バイオ製剤抵抗抗例に100mg/日で適用したHD患者の2症例（Nishimura A, et al: J Rural Med 2022 PMID: 35847752）

【保存期CKD患者への投与方法】 常用量（1）

eGFRとリンパ球数が全身CLの共変量であるが影響は軽度で減量不要（Toyoshima J, et al: Br J Clin Pharmacol 2021 PMID: 33068028）

腎機能はPKに影響しない（Miyatake D, et al: Clin Drug Investig 2020 PMID: 31729626）

【特徴】 既存治療で効果不十分な関節リウマチに適用。JAKファミリー（JAK3）を阻害し、炎症性サイトカインのシグナル伝達や細胞増殖を抑制。

【主な副作用・毒性】 感染症、静脈血栓塞栓症、上咽頭炎、帯状疱疹、肺炎、血球減少、消化管穿孔、肝障害、間質性肺炎、頭痛、消化器症状、皮膚症状、CK上昇など

【安全性に関する情報】悪性腫瘍・静脈血栓塞栓症の発現注意（1）有害事象として好中球減少、頭痛、腹痛がメイン（Cao YJ, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2016 PMID: 27162173）生ワクチン接種不可（1）

【モニターすべき項目】 投与前にB型肝炎チェック（1）投与開始後は定期的に血球、肝機能、脂質などをチェック（1）

【吸収】 空腹時投与でAUC低下（1）ka=5.83/hr（1）食事によりAUCが27%上昇（Cao YJ, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2016 PMID: 27162173）

【F】 データなし（1）

【tmax】 1～2hr（1）

【代謝】 SULT1によりM2に、NNMTによりM4に代謝され、さらにM1に変換（1）

代謝物の活性は弱い（1）

【排泄】 尿中回収率36.8% [po, 216hrまで]（1, Oda K, et al: Xenobiotica 2015 PMID: 25986538）P-gpの基質（1）M2はBCRP, MRP4, OATP1B1, OATP1B3, OAT3の基質（1）

【CL/F】 91.7L/hr（1）

【t1/2】 3.7～7.5hr（1）7.4～13hr（Gao X, et al: Drug Des Devel Ther 2022 PMID: 35586186）

【蛋白結合率】 73～75% [Alb]（1）

【Vd】 資料なし（1）Vd/F 700～1500L/body（Gao X, et al: Drug Des Devel Ther 2022 PMID: 35586186）

【MW】 407.30

【透析性】 資料なし（1）

【O/W係数】 LogP=2.27 [1-オクタノール/水系, pH6.93]（1）pKa=5.74 [消化管吸収に影響]（1）

【薬物動態】 線形動態（Gao X, et al: Drug Des Devel Ther 2022 PMID: 35586186）

【相互作用】 CYP2C8, 3Aを時間依存的に阻害（1）OATP1B1を介する相互作用認めず（Zhu T, et al: Clin Pharmacokinetics 2017 PMID: 27878567）ベラパミル併用でAUCが1.27倍に上昇（Zhu T, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2017 PMID: 28301084）併用によりメトホルミンの腎クリアランスを12.9%低下させた[OCT/MATE系]（Shibata M, et al: Eur J Clin Pharmacol 2020 PMID: 32472157）

MTXとの相互作用認めず（Zhu T, et al: Clin Drug Investig 2020 PMID: 32591978）

【肝障害患者への投与方法】 肝障害は減量対象（Miyatake D, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2020 PMID: 31833184）

【小児CKD患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】 妊婦禁忌、授乳中止（1）

【主な臨床報告】 乾癬への適用試験 phase 2（Papp K, et al: Br J Dermatol 2015 PMID: 25704750）

【更新日】 20240925

※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。