

○ラゲブリオ カプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】モルスビラビル Molnupiravir [EIDD-1931] 【分類】抗ウイルス薬 [抗SARS-CoV-2 : RNA 依存性 RNA ポリメラーゼ阻害剤]

【単位】○200mg/Cap [40 Cap/ボトル包装]

【常用量】1回 800mg (4Cap), 1日2回, 5日間 [18歳以上に適用]

【用法】1日2回, 5日間

症状発現から速やかに投与 [6日目以降開始のデータなし]

【透析患者への投与方法】透析例でのPK試験は未実施 (1) PKからは常用量が適用可能と思われるが効果は限定的 (5)

1日2回投与のうち, HD日の1回はHD後となるように設定する (5)

救急受診頻度が減少し, 早期開始にてウイルス消失が早まる (Chang YC, et al: Int J Antimicrob Agents 2023 PMID: 37127127)

HD患者への適用は死亡率低下と関連していた [BA1/2] (Kikuchi K, et al: Ther Apher Dial 2023 PMID: 37395555)

ワクチンの効果に影響なし (Chen PC, et al: Viruses 2023 PMID: 36851757)

【保存期CKD患者への投与方法】PKは腎機能障害の影響を受けない (1) eGFR 30未満でのPKデータはない (1)

PKからは常用量が適用可能と思われる (5)

CKD患者の死亡リスク15%低下 (Cheng FWT, et al: Kidney Int Rep 2024 PMID: 38707795)

腎障害例ではバキロビッドに比べCOVID-19による死亡や入院の抑制効果は劣っていた (Chu WM, et al: EClinicalMedicine 2024 PMID: 38737003)

【特徴】SARS-CoV-2感染症に適用される抗ウイルス薬

リボスクレオント類似体 β -D-N4-hydroxycytidine (NHC; EIDD-1931) のプロドラッグで重症急性呼吸症候群コロナウイルス2, 重症急性呼吸症候群コロナウイルス, 中東呼吸症候群コロナウイルス, 季節性および流行性インフルエンザウイルスなどの多くのRNAウイルスに対して活性を有する。

軽症, 中等症のうち複数の条件を満たす重症化リスク因子を有する例に適用。ウイルスRNAにNHC-三リン酸が取り込まれ, 変異RNAとなりウイルス増殖を抑制

(Kabinger F, et al: Nat Struct Mol Biol 2021 PMID: 34381216)

【主な副作用・毒性】消化器症状, 頭痛, 浮動性めまい, 皮膚症状など

【安全性に関する情報】投与後4日まで (計9日間) の避妊が必要 (1)

4試験のメタ解析では有害事象の増加認めず (Amani B, et al: Br J Clin Pharmacol 2022 PMID: 35762036)

【吸収】AUCは食事の影響を受けない (1, Nakamura K, et al: Clin Transl Sci 2022 PMID: 36053806)

【F】

【tmax】1.5~1.75hr (1) 1~2hr (Nakamura K, et al: Clin Transl Sci 2022 PMID: 36053806)

【代謝】加水分解により活性体の β -D-N4-hydroxycytidine (NHC) に変換され, 細胞内に取り込まれ, NHC-三リン酸となる (1) 内因性ピリミジン代謝経路にて消失 (1)

【排泄】尿中回収率3% [po] (1)

【t1/2】高用量や反復投与で7.1hr (Painter WP, et al: Antimicrob Agents Chemother 2021 PMID: 33649113)

【蛋白結合率】0% (1)

【Vd】Cmaxからの計算上, 活性体としてはVd/F 290L/body (5)

【MW】329.31

【透析性】一部は除去されると思われる (5)

【薬物動態】治療量で線形 (1, Nakamura K, et al: Clin Transl Sci 2022 PMID: 36053806)

【O/W係数】

【相互作用】設定されていない (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦に禁忌, 授乳はリスクベネフィットにより継続または中止の検討 (1) 授乳再開は治療終了後4日あける (1)

【主な臨床報告】鼻腔スワブPCRによる有用性確認 (Fischer W, et al: medRxiv 2021 PMID: 34159342)

用量設定試験 [phase I] (Khoo SH, et al: J Antimicrob Chemother 2021 PMID: 34450619)

COVID-19軽症例での効果を確認されるが, 中等症 (II) ~重症での効果は証明されていない (Singh AK, et al: Diabetes Metab Syndr 2021 PMID: 34742052)

ワクチン未接種で重症化リスクのある成人COVID-19軽症例 [3割がデルタ株] への早期投与 (5日以内) により, 29日までの入院・死亡のARR 3%, RRR 約30%

[症状の改善は認めず] (Jayk Bernal A, et al: N Engl J Med 2021 PMID: 34914868)

ワクチン未接種者での有用性を示した試験 [phase 2a] (Fischer WA 2nd, et al: Sci Transl Med 2021 PMID: 34941423)

臨床試験中間解析後ではデメリットが上回っている可能性あり (Hayashi K: BMJ 2022 PMID: 35474269)

オミクロン株の流行下での本剤のメリットは限定的と思われる再検証が必要 (Hill A: BMJ 2022 PMID: 35474171)

ワクチン接種例の外来適用では, 有症状期間は短縮 (4日短縮) するものの, 28日間の入院や死亡の抑制効果を抑制しなかった (Butler CC, et al: Lancet 2022 PMID: 36566761)

【備考】一包化できるが, 分包装に挟まれやすいので注意。脱カプセル, 簡易懸濁も可能と思われる。カプセル服用できない場合は, 脱カプセル+水で懸濁で服用がベ

ターか、

【更新日】20241012

※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。