

## ◎コルスバ静注透析用シリソジ [注]

【重要度】 【一般製剤名】ジフェリケファリン酢酸塩 Difelikefalin Acetate 【分類】透析そく症改善剤 [ $\kappa$ オピオイド受容体選択性的作動薬]

【単位】 $\odot 17.5\mu\text{g} \cdot \odot 25.0\mu\text{g} / \odot 35.0\mu\text{g/Syr}$  [全て 0.7mL]

【常用量】DWに応じ1回量を設定

45kg未満:  $17.5\mu\text{g}$

45kg以上65kg未満:  $25.0\mu\text{g}$

65kg以上85kg未満:  $35.0\mu\text{g}$

85kg以上:  $42.5\mu\text{g}$

【用法】週3回、HD終了返血時に静脈回路から投与

【透析患者への投与方法】常用量 (1)

中等度以上の透析搔痒症に対してかゆみの改善と関連するQOL向上が得られた (Fotheringham J, et al: Patient 2024 PMID: 38196014)

かゆみの軽減をもたらす [メタ解析] (Xue G, et al: Clin Nephrol 2024 PMID: 38294219)

かゆみの改善とともに睡眠障害への良好な効果が得られた (Weiner DE, et al: Nephrol Dial Transplant 2023 PMID: 37968132)

【保存期 CKD患者への投与方法】HD例のみに適用 (1)

CKDG3-5/5Dでの経口投与による効果を確認 (Yosipovitch G, et al: J Am Acad Dermatol 2023 PMID: 37059302)

【特徴】 $\kappa$ オピオイド受容体 (KOR) の選択性的作動薬。既存治療で効果不十分な場合の血液透析患者のそく症に適用。慢性肝疾患によるかゆみには適応がない。マウスでは投与後12時間効果が持続している。

【主な副作用・毒性】浮動性めまい、傾眠、血圧低下、ほてり、倦怠感、甲状腺ホルモン低下、TSH低下、プロラクチン増加、頭痛、下痢、精神状態変化など

【安全性に関する情報】自動車運転等禁止 [眼気、めまい] (1) 急に中止しても離脱症状は認められていない (Spencer RH, et al: Clin Transl Sci 2023 PMID: 37128642)

【代謝】代謝されない (1) 代謝酵素やトランスポーターの基質ではなく阻害しない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率80% [健常人]、HD患者は60%糞便中に排泄され、20%がHD除去される (Stark JG, et al: Clin Pharmacokinet 2023 PMID: 37369955)

【t1/2】健常人2~3hr、透析40hr (1) HD患者に反復投与しても透析性が高いためほとんど蓄積しない (1)

【蛋白結合率】23.3~27.5% [HD例] (1)

【Vd】 $0.34\text{L/kg}$  [HD例] (1)

【MW】679.85

【透析性】除去される [濃度低下率76%] (1)

【O/W係数】LogP=-0.54 (1)

【相互作用】オピオイド系薬による相加的あるいは拮抗的作用の可能性 (1)

【肝障害患者への投与方法】

【小児CKD患者における報告】

【妊娠・授乳婦への投薬】妊娠には有益性投与

【主な臨床報告】 $0.5\mu\text{g/kg}$ を適用して検証したphase2 (Narita I, et al: JAMA Netw Open 2022 PMID: 35511180)

HD患者のNRSスコアを改善 (Narita I, et al: NEJM Evid 2023 PMID: 38320524)

電解質利尿と血圧の低下をもたらす [ラット] (Meariman JK, et al: Pharmacol Res 2022 PMID: 36202183)

経口剤(0.25~1mg)にてアトピー性皮膚炎によるかゆみを改善 (Guttman-Yassky E, et al: J Allergy Clin Immunol 2023 PMID: 37453614)

【更新日】20241022

※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、適合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ーネットフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断複数・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。