▼レズロック錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】ベルモスジル メシル酸塩　Belumosudil Mesilate　【分類】選択的ROCK2阻害剤
【単位】▼200mg/錠
【常用量】200mg/日［最大400mg分2］
【用法】1日1回食後（増量時1日2回）
【透析患者への投与方法】常用量（1）
【保存期CKD患者への投与方法】常用量（1）
【特徴】T細胞受容体シグナル伝達を含むT細胞免疫応答の調整，細胞骨格系再構築及びエフェクターT細胞の機能獲得におけるシグナル伝達経路にあるROCK2のキナーゼ活性を阻害．造血幹細胞移植後の慢性移植片対宿主病（ステロイド剤の投与で効果不十分な場合）に適用.
【主な副作用･毒性】肺炎・帯状疱疹などの感染症，頭痛，肝機能障害，末梢性ニューロパチー，高血圧，甲状腺機能低下症，消化器症状など
【安全性に関する情報】QT延長に関与しない（Schueller O, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2022 PMID: 35881051）
【吸収】空腹時投与で吸収低下（1）溶解度はpHの上昇により低下（1）PPI併用で未変化体と代謝物両者のAUC低下（Schueller O, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2022 PMID: 35230741）
【F】63.7%（1）
【tmax】2～4hr（1）
【代謝】主にCYP3A4で代謝・阻害（1）CYP2C8，CYP2D6，UGT1A9も関与（1）
【排泄】尿中未変化体排泄率0%，尿中回収率4%（1）尿中排泄はわずか（Schueller O, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2022 PMID: 35231159）
【CL】256mL/min［iv］（1）
【t1/2】6.4hr（1）
【蛋白結合率】99%以上（1）
【Vd】Vss=53.2L/body［iv］（1）
【MW】548.61［salt］
【透析性】資料なし（1）除去されない（5）
【O/W係数】
【相互作用】PPI又は強いCYP3A4誘導剤との併用により本剤の血中濃度が低下する可能性があり，効果不十分な場合は1回200mg1日2回に増量可（1）P-gp，BCRP，OATP1B1を阻害（1）
タクロリムスの用量を25%減，シロリムスの用量を25～50%減するほどの相互作用が確認（Gonzalez R, et al: Transplant Cell Ther 2023 PMID: 37355201）
【主な臨床報告】慢性移植片対宿主病に対しての全奏効率は200～400mg/日の範囲で60%台（Jagasia M, et al: J Clin Oncol 2021 PMID: 33877856）
【更新日】20240921

※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。