

ヤヌスキナーゼ（JAK）阻害薬について

JAK阻害薬は、炎症性サイトカインによる刺激が細胞内に伝達される際に必要なJAKという酵素を阻害する薬で、当院では主に関節リウマチに対して使用されています。現在関節リウマチを適応とするJAK阻害薬は5剤あり、各薬剤を比較してみました。

薬剤名 (商品名)	トファシチニブ (ゼルヤンツ®)	バリシチニブ (オルミエント®)	ペフィシチニブ (スマイラフ®)	ウパダシチニブ (リンヴォック®)	フィルゴチニブ (ジセレカ®)
発売年月	2013/7	2017/9	2019/7	2020/4	2020/11
製剤写真					
規格・薬価 (2025.4) (赤は院内採用)	5mg:2260.9円	2mg:2472.5円 4mg:4820円 他1mgもあり	50mg:1280.6円 100mg:2503.8円	7.5mg:2205.4円 15mg:4325.8円 他30mg、45mgもあり	100mg:2141.9円 200mg:4159.6円
作用機序	JAK1、2、3を阻害	JAK1、2を阻害	JAK1、2、3、TYK2を阻害	JAK1、(2)を阻害	JAK1を阻害
用法用量	1日2回、1回5mg	1日1回、1回4mg 治療効果が認められた際には1回2mgへの減量を検討	1日1回、1回150mg（食後） 状態に応じて1回100mgに減量	1日1回、1回15mg 状態に応じて1回7.5mgに減量	1日1回、1回200mg 状態に応じて1回100mgに減量
腎機能調節	中等度・重度の腎障害患者は1日1回5mgに減量	30 ≤ eGFR < 60は1日1回2mgに減量 eGFR < 30は禁忌	不要	不要 ただし、副作用が強くあらわれるおそれがある	15 ≤ eGFR < 60は1日1回100mgに減量 eGFR < 15は禁忌
肝機能調節	中等度の肝障害患者は1日1回5mgに減量 重度の肝障害患者は禁忌	不要 ただし、副作用が強くあらわれるおそれがある	中等度の肝障害患者は1日1回50mgに減量 重度の肝障害患者は禁忌	軽度・中等度の肝障害患者は不要、ただし、副作用が強くあらわれるおそれがある 重度の肝障害患者は禁忌	重度の肝障害患者は禁忌
その他の調節	なし	プロベネシドとの併用時は1日1回2mgに減量	なし	なし	なし
代謝/排泄	主にCYP3A4、一部CYP2C19	主に腎排泄	主に硫酸縫合	主にCYP3A4	主に腎排泄
尿中未変化体排泄率	約29%	69%	12.5～16.8%	24%	約54% (活性代謝物)
半減期	2.49時間	6.39時間(4mg)	7.5時間(200mg)	8.25時間(15mg)	6.35時間(200mg)
関節リウマチ以外の適応	潰瘍性大腸炎	アトピー性皮膚炎 若年性特発性関節炎 SARS-CoV-2 円形脱毛症	なし	乾癬性関節炎 体軸性脊椎関節炎 強直性脊椎炎 巨細胞性動脈炎 アトピー性皮膚炎 潰瘍性大腸炎 クローン病	潰瘍性大腸炎
免疫抑制剤との併用 (添付文書の記載)	本剤とTNF阻害剤、IL-6阻害剤、T細胞選択的共刺激調節剤等の生物製剤や、タクロリムス、アザチオプリン、シクロスポリン、ミゾリビン等の強力な免疫抑制剤(局所製剤以外)との併用はしないこと	本剤と抗リウマチ生物製剤や他の経口JAK阻害剤との併用はしないこと	本剤とTNF阻害剤、IL-6阻害剤、T細胞選択的共刺激調節剤等の生物製剤や、他のJAK阻害剤等の強力な免疫抑制剤(局所製剤以外)との併用はしないこと	本剤と適応疾患の生物製剤、他の経口JAK阻害剤、タクロリムス、シクロスポリン、アザチオプリン、ミゾリビン等の強力な免疫抑制剤(局所製剤以外)との併用はしないこと	本剤と抗リウマチ生物製剤や他のJAK阻害剤、タクロリムス、シクロスポリン、アザチオプリン、ミゾリビン等の強力な免疫抑制剤(局所製剤以外)との併用はしないこと
その他の併用注意薬	CYP3A4阻害剤 CYP3A4誘導剤 フルコナゾール 肝障害を起こす可能性のある薬剤	プロベネシド(本剤がOAT3の基質であり、プロベネシドはOAT3を阻害するため)	肝障害を起こす可能性のある薬剤	CYP3A4を強く阻害する薬剤 CYP3A4を強く誘導する薬剤	なし
その他		懸濁可能		粉碎不可	精子形成障害があり、妊娠性が低下する(男性)
禁忌	・本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者 ・重篤な感染症(敗血症等)の患者[症状を悪化させるおそれがある。] ・活動性結核の患者[症状を悪化させるおそれがある。] ・好中球数が500/mm ³ 未満の患者(ゼルヤンツ、オルミエント、スマイラフ)、1000/mm ³ 未満の患者(リンヴォック、ジセレカ) ・リンパ球数が500/mm ³ 未満の患者 ・ヘモグロビン値が8g/dL未満の患者 ・妊婦又は妊娠している可能性のある女性 ※腎機能、肝機能による禁忌は腎機能・肝機能調節の欄に記載				