

△チガソソカプセル [内]

【重要度】★★

★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】 エトレチナート (U) etretinate 【分類】 角化症治療薬

【単位】 △10mg・▼15mg/Cap

【常用量】 ■寛解導入量：40～50mg/日を2～4週間 [最大75mg/日] ■寛解維持量：10～30mg/日

【用法】 1日1～3回

【透析患者への投与方法】 本剤の作用が増強するおそれがあるため禁忌 (1)

【保存期CKD患者への投与方法】 本剤の作用が増強するおそれがあるため禁忌 (1)

【特徴】 VAは皮膚・粘膜の正常保持作用を有することは知られていたが、角化症治療には大量投与を必要とするため、肝における過剰蓄積をはじめ、神経毒性や全身の高度の副作用発現により臨床応用には限界があった。本剤は毒性を軽減し治療効果を増大したエトレチナート製剤であり、選択的に抗角化作用を高めた治療薬で、視覚・聴覚作用等を示さない。重症乾癬患者や魚鱗癬患者、重症の口腔粘膜角化性病変などの重症の皮膚角化異常症に効果を発揮する。

【主な副作用・毒性】 肝障害、口唇炎、落屑、口内乾燥、皮膚菲薄化、搔痒、TEN、多形紅斑、血管炎など

【安全性に関する情報】 催奇形性あり (1) 服用時及び服用中止後 [女性2年間、男性6か月間] の避妊が必要 (1)

【吸収】 小腸から吸収される (U) 吸収率40%、牛乳で服用すると水に比し血中濃度は2.6倍上昇する。また絶食時に比し高脂肪食と服用したときには血漿濃度は4.5倍上昇する (1)

【F】 30～70% (1) 40% (11)

【Tmax】 未変化体3～5hr、活性代謝物4～8hr (1) 2～6hr (U)

【代謝】 初回通過効果により活性体に変換され、脱エチル体の活性代謝物となる (1) 腸管および肝臓で活性代謝物の脱エチル体に代謝される。吸収されたエトレチナートもほぼ100%が活性代謝物に代謝される。活性代謝物は主に腎にて非活性代謝物に代謝されて尿中に排泄されるが、一部は腸肝循環により糞便中に排泄される。脱エチル体は未変化体よりも強い活性を有する (1) エチルエステルの分解により水溶性のカルボキシル体の etretin (活性を有する) に代謝される (11)

【排泄】 肝および腎 (U) 未変化体、活性代謝物ともに尿中には認められない (1) 活性代謝物：10～20%が尿中排泄 (11)

【t1/2】 未変化体1～3hr、活性代謝物3～5hr、長期投与では脂肪組織 (主に皮下脂肪) に取り込まれたエトレチナートが徐々に血中に流出するため約100日 (1) 120日 (U) 長期投与されると2.1～2.9年後にも血中に検出される (U) 6～13hr (11)

【蛋白結合率】 99%以上 (1) 99% (U) リポプロテインに結合。活性代謝物の acetretin (etretin) はアルブミンに結合 (1,U)

【Vd】 主に皮下脂肪等の脂肪組織に貯留する (1) 肝や脂肪組織に高濃度に蓄積 (U)

【MW】 354.49

【透析性】 除去されないと思われる (5)

【TDMのポイント】 有効血中濃度には個人差があり設定が困難なため、TDMの対象とはならない (1)

【相互作用】 他のビタミンA製剤と併用禁忌 (1) フェニトインの蛋白結合率を低下させることがある (1)

【更新日】 20200907

※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。