

## △ジャドニユ顆粒分包 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】デフェラシロクス Deferasirox 【分類】経口鉄キレート剤

【単位】▼90mg・△360mg/顆粒

【常用量】12mg/kg [最大 18mg/kg]

▼1 ヶ月あたりの輸血量がRCC 7mL/kg 未満 (成人では4 単位/月未満に相当) の場合は、初期投与量 (1 日量) として6mg/kg を考慮

▼中等度 (Child-Pugh 分類クラス B) の肝機能障害: 開始用量を約半量に減量

▼用量調節には3~6 か月毎の血清フェリチン, 安全性, 治療目的等を評価して3~6mg/kg の間で段階的に増減

※懸濁剤の0.6 倍量が顆粒に相当

【用法】経口投与 (食事に関係なく投与可)

▼開始後は毎月血清フェリチンを確認

▼中止のめやす: 血清フェリチン 500ng/mL

RCC 約 100mL/kg 以上 (成人では約 40 単位以上に相当) の輸血を受けた場合  
輸血による慢性鉄過剰症の所見として、血清フェリチンが継続的に高値を示す場合  
注射鉄キレート剤が適用できない場合

原疾患の支持療法のために現在及び今後も継続して頻回輸血を必要とする場合  
に適用を考慮

【透析患者への投与方法】硬度腎障害には禁忌 (1)

【その他の報告】懸濁剤として 500mg/日から開始し、血清フェリチン値が減少傾向を示すまで徐々に増量し、血清フェリチン値が 1000ng/mL 未満で減量し、467ng/mL  
の時点で中止した症例 [MDS に 9 か月間投与] (福井信二, 他: 透析会誌 42: 865-9, 2009)

エクジエイド錠として 10mg/kg では目標血中濃度に達しないが 15mg/kg なら十分 (Maker GL, et al: Nephrology (Carlton) 2013 PMID: 23332024)

懸濁剤として (DFO から切り替え) 初回 15mg/kg/日, 最大 30mg/kg/日まで漸増, 維持量は 10mg/kg/日の設定 [発作性夜間血色素尿症] (Tsai CW, et al: Hemodial Int 2013 PMID: 22549006)

懸濁剤として初回 20mg/kg/日, 副作用発現後に休薬・中止 [鎌状赤血球腎症] (Yusuf B, et al: Am J Kidney Dis 2008 PMID: 18534729)

懸濁剤として初回 10mg/kg/日, 血清フェリチン上昇のため 20mg/kg/日に増量 [再生不良性貧血] (Hiraga J, et al: Int J Hematol 2011 PMID: 21431347)

顆粒として 12mg/kg 投与可であるが、緊急性がない場合や毒性リスクを考慮するなら 6mg/kg も選択肢 (5)

【PD】エクジエイド錠として 1000mg/日で適用した PD 症例があり、PD 液中への鉄錯体の移行は軽度で接合菌感染リスクが高くなるほどではないだろうと推測 (Yui E, et al: Nephrology (Carlton) 2018 PMID: 29663590)

【保存期 CKD 患者への投与方法】高度腎障害には禁忌 (1)

【その他の報告】データなし (17) 腎機能をモニターして 50%に減量を考慮 (FDA)

開始量は顆粒として 12mg/kg 投与可であるが、緊急性がない場合や毒性リスクを考慮するなら 6mg/kg も選択肢 (5)

腎機能障害者では開始 4 週間もしくは投与量変更後 4 週間には毎週 Scr を測定 (1)

腎障害出現時は 6mg/kg 減らす (1)

【特徴】輸血による慢性鉄過剰症 (注射用鉄キレート剤治療が不適当な場合) に適用される鉄除去剤。3 価の鉄 1 分子に対し鉄原子と 3 座の錯体を形成するように至適化された幾何学的配置をとり、デフェラシロクス 2 分子が錯体を形成することでキレート作用を発揮する。銅、亜鉛イオンなど 2 価の金属に比較し、鉄イオン Fe(III) などの 3 価の金属に対する選択性が高い。顆粒は錠剤の 60%量で同等である。

【主な副作用・毒性】ショック, アナフィラキシー, SJS, 多形紅斑, 急性腎不全, 消化管穿孔, 肝炎, 下痢, 悪心, 嘔吐, 血中 Cre 増加, 尿中 BMG 増加など。下痢は特に高齢者に多い。

【安全性に関する情報】開始前に Scr を 2 回測定, 開始後は 4 週毎に測定 (1) Scr が 33%超で上昇していれば 6mg/kg 減量し, さらに進行する場合は休薬 (1) 近位尿細管障害の可能性があるので, フェリチン 1000 以下にならば減量考慮 (Yui JC, et al: Vox Sang 2021 PMID: 33529394)

【モニター項目】消化器症状, フェリチン: 月 1 回, Scr: 最初の 1 か月は週 1 回, 肝機能: 最初の 1 か月は 2 週に 1 回

【吸収】懸濁剤: 食後投与で吸収率が增大するので空腹時に投与し, 投与後 30 分間は食事をとらない (1) 顆粒: 食事に関係なく投与可 (1)

【F】73.5% (1) 顆粒は懸濁剤の 60%量と生物学的に同等 (1)

【tmax】

【代謝】UGT1A1/A3 によりグルクロン酸結合を受け, 一部 CYP1A2 及び CYP2D6 により酸化代謝を受ける (1)

【排泄】主に未変化体として糞便中に 84%, 尿中に 8%が排泄される [168hr まで] (1)

【CL】  $3.53 \pm 0.87 \text{L/hr}$  [iv] (1)

【t<sub>1/2</sub>】 13~20hr (1)

【蛋白結合率】 99% [アルブミンと結合] (1)

【Vd】 14L/man (1)

【MW】 373.36

【透析性】 透析されないとされる (5)

【薬物動態】 高度肝障害患者には禁忌, 中等度肝障害患者には開始量を 50% に減量 (1)

【O/W 係数】 47 [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】 CYP3A4 を軽度誘導し, CYP1A2, 2C8 を阻害する (1) CYP2C8 で代謝されるレバグリニド, トレプロスチニルの血中濃度が上昇 (1) テオフィリンの血中濃度上昇 (1) クロピドグレルとの相互作用が存在するかもしれない (5)

【効果発現時間】 3hr 後には胆汁中鉄排世の増加が認められる [ラット] (1)

【備考】 服用感を改善するにはリンゴジュースやスポーツドリンクでの懸濁を考慮, DFO と異なり, 接合菌など真菌感染症を抑制する可能性がある (松原悦子, 他: 第 62 回日本化学療法学会抄録 p311, 2014)

【更新日】 20230117

---

※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。