

△ケアラム錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】イグラチモド Iguratimod 【分類】関節リウマチ治療薬 [DMARDs]

【単位】△25mg/錠

【常用量】25mg/日 [朝] で4週以上経過後に50mg/日 [朝・夕] に増量■初期量を50mg とすると肝機能検査値異常の発現率が高い

【用法】25mg は朝食後、50mg は朝・夕食後■通常16週まで投与後に効果を判定

【透析患者への投与方法】副作用の発現が増加するおそれがあるため慎重投与 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】副作用の発現が増加するおそれがあるため慎重投与 (1)

【特徴】クロモン骨格を有する抗リウマチ剤。作用機序として転写因子 NF κ B の活性化を阻害、B リンパ球に直接作用し免疫グロブリン (IgG、IgM) の産生を抑制、単球マクロファージに作用し、TNF α 、IL-1 β 、IL-6 などの炎症性サイトカインの産生を抑制、などが推測されている。

【主な副作用・毒性】肝障害、血球減少、消化性潰瘍、間質性肺炎、感染症、消化器症状、尿蛋白など。

【安全性に関する情報】副作用の発現率が高いため長期投与時には肝機能検査など副作用の評価を行うべきである (Hara M, et al: Mod Rheumatol 17: 10-16, 2007)

【吸収】食事の影響を受けない (1)

【F】95% [ラット] (1)

【tmax】4hr (1)

【代謝】主代謝物はホルミルアミノ基の脱ホルミル体である M1 と、M1 のアミノ基がアセチル化された M2 で、いずれも活性がある (1) M1 から M2 への代謝反応には肝臓の N-アセチルトランスフェラーゼが関与 (1) 代謝には複数の CYP が関与しているが、M1 は CYP2E1 により生成 (1)

【排泄】尿中活性体 [未変化体, M1, M2] 排泄率1%未満 (1) 尿中回収率20%で主に M3, M4 (1)

【CL】CL/F=40~50mL/min [po], 腎 CL=0.04mL/min (1)

【t1/2】10~17hr (1)

【蛋白結合率】93% (1)

【Vd/F】20~26L/man [po] (1)

【MW】374.37

【透析性】資料なし (1) 透析性は低いと思われる (5)

【O/W 係数】46 [1-オクタノール水系, pH7.0] (1) 【薬物動態】2-コンパートメントモデルに適合 (1)

【相互作用】ワルファリンの作用増強のため併用禁忌 (1) ビタミン K 依存性の凝固機序を低下させる機序が想定 (山本哲也, 他: 薬学雑誌 136: 905-11, 2016)

【備考】SASP と効果や副作用が同等で、他の DMARDs 不応例にも8週以内に効果がある (Hara M, et al: Mod Rheumatol 17: 1-9, 2007) MTX 単独よりも本剤併用の方が効果が高く安全性は同等 (Ishiguro N, et al: Mod Rheumatol 23: 430-439, 2013) MTX や SASP と効果は同等 (Li J, et al: Clin Dev Immunol 2013)

【更新日】20211202

※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・配付を禁じます。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。