

△クリノリル錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 スリンダク (U) sulindac 【分類】 非ステロイド性消炎・鎮痛剤

【単位】 △100mg・▼50mg/錠

【常用量】 300mg/日

【用法】 分2食後

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし。遊離型スリンダク濃度は健常者と同等だが、遊離型および総活性代謝物濃度は健常者よりも低い (J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993) 【その他の報告】 減量の必要なし (4) 50~100% (3)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要はないが、腎障害悪化の恐れがあるためできるだけ投与しない (5) 【その他の報告】 減量の必要なし (ただし常用量の設定 200mg/日) (12) GFR<50mL/min では 50~100% (3) 重篤な腎障害のある患者には投与禁忌、腎障害又はその既往歴のある患者には慎重投与 [PG 合成阻害作用により、腎血流量低下及び水、ナトリウムの貯留が起こるため腎障害が悪化 (または再発) するおそれがある] (1)

【特徴】 プロドラッグであり、胃腸管への良好な忍容性がある。活性体のままでは腎排泄されないため、腎機能に及ぼす影響が少ない。降圧剤との併用でもその降圧効果にほとんど影響を与えない。持続的な抗炎症・鎮痛作用がある。

【主な副作用・毒性】 高カリウム血症、急性腎不全、間質性腎炎、ネフローゼ症候群、肝機能障害 (胃腸障害、腎障害は比較的弱い)、喘息発作誘発、味覚異常など

【モニターすべき項目】 BUN、血清 Cr、血清 K、ヘマトクリット、ヘモグロビン、検尿、便潜血、血算、肝機能、眼科検診、上部消化管診断

【吸収】 90% (11)

【F】 88%以上 (10)

【tmax】 活性代謝物の tmax は空腹時 2hr、食物摂取後 3~4hr (11) 5.3hr (1) sulindac 1.7hr、sulindac sulfide 7.7hr (13) 【Cmax】 健常者に空腹時に 300mg 単回経口投与したときの Cmax は sulindac 11 μg/mL、sulindac sulfide 7.7 μg/mL (13)

【代謝】 肝で活性代謝物 sulindac sulfide になる (U) sulindac sulfide は親化合物の 2~5 倍の活性を持つ (J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993)

【排泄】 尿中回収率 50% (U) 活性体としての尿中排泄率 1%未満 (U) 7% (10,12) 20%が未変化体および代謝物として尿中排泄 (6) 胆汁に排泄され腸肝循環する (11) 無視できるくらい低い (13) 【腎 CL】 9.1mL/hr/kg、スルフォン体 3.1mL/hr/kg (1)

【t1/2】 ■スリンダク 7~8hr (11) 7.8hr (U) 2 相性で 8hr (4) 17hr (6) 3hr (13) 18hr (6) 2.95hr (J Clin Pharmacol 33:527-534,1993) ■スルフィド体 16~18hr (11) 18hr (10) 16hr (4) 12.9hr (13) 【透析患者の t1/2】 スリンダクは 1.98hr、活性体は 15.6hr で正常腎機能者と同じ (J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993)

【蛋白結合率】 93% (11) 90% (U) 95% (12) 96% (10) sulindac 93.1%、sulfide 代謝物 95.4%、sulfone 代謝物 97.9% (11) sulindac 94%、sulindac sulfide 94%、腎疾患で低下 (13) 【腎不全患者の蛋白結合率】 腎不全で低下するが透析により上昇する (J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993)

【Vd】 2L/kg (1)

【MW】 356.42

【透析性】 親化合物、活性体ともに除去されない (J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993) 資料なし (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない 【O/W 係数】 0.28 (11) 0.11 [エーテル/水系, pH7.5]、スルフィド体 90 [エーテル/水系, pH7.5] (1) 【pKa】 4.5 (1)

【慎重投与】 ACE 阻害薬、ARB: 腎機能が悪化している患者では、さらに腎機能が悪化するおそれ (1)

【更新日】 20180407

※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。