

▼サデルガ カプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エリグルスタット酒石酸塩 eliglustat tartrate 【分類】 グルコシルセラミド合成酵素阻害薬

【単位】 ▼100mg/cap

【常用量】 ■CYP2D6 の EM・IM : 1回 100mg を 1日 2回

■CYP2D6 の PM : 投与を避けることが望ましいが、1回 100mg 1日 1回を目安に慎重投与

■CYP2D6 の UM : 血中濃度が低くなり効果が減弱するおそれがあるため投与を避けることが望ましい

【用法】 1日 1~2回

【透析患者への投与方法】 特に設定されていないが、腎障害患者には慎重投与 [使用経験が少ない] (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 慎重投与 [使用経験が少ない] (1)

【特徴】 グルコシルセラミド合成酵素を選択的に阻害しグルコシルセラミドの生成を抑制する。ゴーシェ病の諸症状（貧血、血小板減少症、肝脾腫及び骨症状）の改善に適用される。CYP2D6 により代謝されるので、事前に遺伝子型を確認しなければならぬ。

【主な副作用・毒性】 失神、消化器症状、頭痛、浮動性めまい、疲労、関節痛など

【安全性に関する情報】 過量投与時の症状は、平衡異常を伴うめまい、低血圧、徐脈、悪心及び嘔吐などで、対症療法 (1) 10mg/kg 以上で QT 軽度の延長 (Peterschmitt MJ, et al: J Clin Pharmacol 51: 695-705, 2011 PMID: 20864621)

【吸収】 食事の影響を受けない (Peterschmitt MJ, et al: J Clin Pharmacol 51: 695-705, 2011 PMID: 20864621)

【F】 4.49±4.13% (1)

【tmax】 1.5hr (1)

【代謝】 主に CYP2D6、部分的に CYP3A4 で代謝 (1) CYP2D6 の PM では主に CYP3A4 で代謝 (1) P-gp の基質である (1) 代謝物のうち 5-カルボキシ体が最多であり、他の代謝物を含めて活性や毒性は低い (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1.5%未満 [po, 8hr まで] (Peterschmitt MJ, et al: J Clin Pharmacol 51: 695-705, 2011 PMID: 20864621) 1%未満 (1) 尿中に 42%回収 (1)

【CL】 85.8±10.4L/hr [iv], CL/F=3493±2364L/hr [po] (1)

【t1/2】 平均 6.8hr (Lukina E, et al: Blood 116: 893-9, 2010) ke=0.0847/hr (1)

【蛋白結合率】 76.4~82.9% (1)

【Vd】 816L/man [iv] (1) 【分布】 P-gp の基質であり、脳内にはほとんど移行しないと推定 (1)

【MW】 959.17 (塩)

【透析性】 資料なし (1) おそらく透析性は低いと思われる (1)

【O/W 係数】 LogP=2.84 (1) 【薬物動態】 反復投与で非線形 [フェニトイン型] (Peterschmitt MJ, et al: J Clin Pharmacol 51: 695-705, 2011 PMID: 20864621) [pKa] 8.79±0.03

【相互作用】 CYP2D6, 3A4, P-gp の基質でありそれぞれを阻害する (1)

【肝障害患者への投与方法】 重篤な肝障害患者への投与は避ける (1)

【主な臨床報告】 Hb や血小板の有意な上昇、脾腫の改善、肝腫大の改善、腰椎 BMD の上昇などが得られている (Lukina E, et al: Blood 116: 893-9, 2010, Mistry PK, et al: JAMA 313: 695-706, 2015 PMID: 25688781)

【更新日】 20190131

※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。