

▼テクフィデラカプセル [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】フマル酸ジメチル dimethyl fumarate (BG-12) 【分類】多発性硬化症治療剤

【単位】▼120mg・▼240mg/cap

【常用量】1回 120mg1 日 2回から開始し、1週間後に1回 240mg1 日 2回に増量

■主な副作用の潮紅、消化器系副作用等が認められた場合には1か月程度の期間1回 120mg1 日 2回投与に減量可。その後1回 240mg1 日 2回投与への再増量に対して忍容性が認められない場合は投与を中止

【用法】1日2回朝・夕

【透析患者への投与方法】データがない (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】重度の腎障害患者は血中濃度が上昇するおそれがあり慎重投与 (1)

【特徴】多発性硬化症の再発予防及び身体的障害の進行抑制の治療薬。酸化ストレスに対する抗酸化応答を介した細胞防御機構である Nrf2 経路の活性化により、脱髄及び神経変性等に拮抗する機序が考えられている。

【主な副作用・毒性】リンパ球減少、白血球減少、潮紅、消化器症状、進行性多巣性白質脳症、急性腎不全、肝機能障害、アナフィラキシー、皮膚症状など、

【安全性に関する情報】過量投与時に発現した症状は潮紅、悪心、腹痛などであり対症療法 (1) 消化器症状により脱水から AKI に至るケースがあるため注意 (1) 進行性多巣性白質脳症の症例報告 (Bartsch T, et al: Ann Neurol 78: 501-14, 2015 PMID: 26150206) CD8 リンパ球の減少に関連 (Khatiri BO, et al: Mult Scler Relat Disord 4: 377-9, 2015 PMID: 26195059) 平均 3.9 か月後に総リンパ球数として 35%低下 (Berkovich R, et al: Mult Scler Relat Disord 4: 339-41, 2015 PMID: 26195053)

【F】不明 (1)

【tmax】モノメチル体として 4~5hr (1)

【代謝】全身循環前にエステラーゼにより急速に加水分解され、活性代謝物であるフマル酸モノメチルに代謝 (1) CYP は代謝に関与しない (1) モノメチル体への分解は胃では起こらないが小腸では起こる pH 依存性がある。また血漿中よりも全血中の半減期が短縮するため、血球に代謝酵素が存在すると考えられる (Litjens NH, et al: BMC Pharmacol 4: 22, 2004 PMID: 15479475)

【排泄】尿中に未変化体は排泄されない (1) 尿中回収率 15.5% [po, 7 日まで] (1)

【t1/2】モノメチル体として 40min (1)

【蛋白結合率】27~40% (1)

【Vd/F】60~90L/man (1)

【MW】144.13

【透析性】透析性は高いと推測される (5)

【薬物動態】線形動態 (1)

【O/W 係数】0.77 [1-オクタノール/水] (1)

【主な臨床報告】脳 MRI にて病変容積の減少を確認 (Miller DH, et al: Neurology 84: 1145-52, 2015 PMID: 25681448) 再発多発性硬化症への経口治療剤として有用 (Kita M, et al: Mult Scler 20: 253-7, 2014 PMID: 24150778) 再発寛解型多発性硬化症への適用では 12 週以内に効果を示し、その効果は 2 年間維持されている (Kappos L, et al: Eur J Neurol 22: 664-71, 2015 PMID: 25557371)

【更新日】20171019

※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。