

◎ウパシタ静注透析用シリンジ [注]

【重要度】 【一般製剤名】 ウパシカルセト ナトリウム 水和物 Upacicalcet Sodium Hydrate 【分類】 カルシウム受容性作動薬 [カルシミメティクス]

【単位】 ◎25 μ g・◎50 μ g・◎100 μ g・◎150 μ g・▼200 μ g・▼250 μ g・▼300 μ g/シリンジ [1mL]

【常用量】 25 μ gから開始, 以後50 μ gに増量し, Ca, PTHに応じて50 μ gずつ増量可 [1回25~300 μ gの範囲]

増量間隔は2週間以上

血清Ca 9.0mg/dL以上なら50 μ gから開始も考慮

【用法】 HD終了時にV側から注入 [筋注, 皮下注不可]

【透析患者への投与方法】 常用量 (1)

【保存期 CKD患者への投与方法】 適用できない (1)

【特徴】 維持血液透析患者の二次性副甲状腺機能亢進症に適用される注射カルシミメティクス。グルタチオン誘導体で, CaSRの細胞外ドメインに結合しアロステリック活性化によりPTHを抑制。エテルカルセチドに比べ分子量が1/3, 消失はほぼHDに依存する。

【主な副作用・毒性】 低Ca血症, 水晶体混濁, 胃腸障害, めまい, 肝機能障害など

【安全性に関する情報】 低Ca血症, QT延長に注意 (1)

【モニターすべき項目】 Ca, PTH

【F】

【tmax】

【代謝】 代謝を受けにくく血中に90%以上が未変化体で存在 (1) 一部は抱合, 脱アミノ化を受ける (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率79~95% [健常人, iv] (1)

【t1/2】 ほぼHDクリアランスに依存 (1) 健常人では1~2hr (Koiwa F, et al: Drugs R D 2022 PMID: 35338469)

【蛋白結合率】 40~45% (1)

【Vd】 15L/body (1)

【MW】 373.75 [dehydrate]

【透析性】 極めて除去されやすい (1) 除去率80% (Kazama JJ, et al: Clin Pharmacokinet 2022 PMID: 35763247)

【O/W係数】 LogP=-2.7未満 [1-オクタノール水系] (1)

【薬物動態】 HD患者で線形で, i-PTHやCaの低下は用量依存的 (Kazama JJ, et al: Clin Pharmacokinet 2022 PMID: 35763247)

【相互作用】 CYPを誘導しない (1) MDR1, BCRPの基質・阻害剤ではない (1) トランスポータを阻害しない (1) 低Caを誘発する薬剤との併用注意 (1)

【主な臨床報告】

【備考】 創薬起点のグルタチオンは「コク味」と関連し, CaSRは味蕾にも存在している。

【更新日】 20240911

※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。