

○チウラジール錠 ▼プロバジール錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】プロピルチオウラシル [PTU] (U) Propylthiouracil 【分類】抗甲状腺剤

【単位】○50mg/錠

【常用量】■初期量300mg/日 [重症時400~600mg/日] ■維持量50~100mg/日

【用法】分1~4

【透析患者への投与方法】50%に減量 (4,6,11) という総説もあるが、減量の必要なし (2,12) という総説もあり意見の一致を見ない (5)

【その他の報告】50%に減量 (3)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr>50mL/min : 減量の必要なし, Ccr10~50mL/min : 75%に減量, Ccr<10mL/min : 50%に減量 (10) という報告もあるが減量の必要なし (12) という報告もあり一致を見ない (5)

【その他の報告】GFR 10~50ml/min では75%に減量する (11)

減量の必要なし (12)

GFR 10~50mL/min : 75%に減量, GFR<10mL/min : 50%に減量 (3)

【特徴】甲状腺ホルモン生成を阻害し、甲状腺機能亢進症に対して用いられる。T3, T4 濃度を正常化するまで約6~8週間必要。チアマゾールに比し胎盤通過性、乳汁移行が少ない。組織破壊による甲状腺中毒症には無効。

【主な副作用・毒性】アナフィラキシー、汎血球減少、再生不良性貧血、無顆粒球症、劇症肝炎等の重篤な肝障害、SLE 様症状、間質性肺炎、ANCA 関連血管炎、DIHS、脱毛、消化器症状、頭痛、発疹、浮腫、味覚異常、筋肉痛など

【安全性に関する情報】無顆粒球症に対してはG-CSF投与も効果がないという報告有り (Thyroid 9: 29-31,1999)

【モニターすべき項目】CBC (像)、甲状腺ホルモン、TSH

【吸収】小腸における吸収は速やか (11) ka=0.047/min (1)

【F】65~70% (U) 33%が初回通過効果で消失 (U) 50~75%で、残りの吸収されなかったものは糞便中に排せられるか初回通過効果を受けて消失する (11) 80% (14) 平均77% (1)

【tmax】1.99hr (U) 1hr (11)

【代謝】肝代謝、主にグルクロン酸抱合 (U)

【排泄】尿中未変化体排泄率0.5~5.7% [po, 245hr まで] (1) 1%以下 (U) 10%以下 (12) 0% (14) 乳汁中排泄はメルカゾールに比し低い (Clin Pharmacokin 6: 401-28,1981) 尿中に75~90%回収される (1)

【CL】117mL/min (10) 7L/hr (U) 120mL/min/m² (Clin Pharmacokin 6: 401-28,1981) 【非腎CL/総CL】90% (10)

【t1/2】1.5hr (10) 1.4hr (14) 1~2hr (12, Clin Pharmacokin 6: 401-28,1981) α相6.3min, β相1.3hr, 半減期は短いのが甲状腺には最低24hrとどまる (11) 【透析患者のt1/2】8.5hr

【蛋白結合率】76% (1) 80% [主にAlb] (U,12) 80% (Clin Pharmacokin 6: 401-28,1981) 56.5±1.1% (4)

【Vd】0.4L/kg (1,U,10) 30L/man (Clin Pharmacokin 6: 401-28,1981) 0.36L/kg (14) 0.3~0.4L/kg (12)

甲状腺組織内に移行しにくいので、1日3回投与が推奨 (ハセドウ病治療ガイドライン2019)

【MW】170.23

【透析性】3hrのHDにて投与量の5%が除去される (1,U)

【TDMのポイント】有効治療域2~6μg/mL (14) TDMは実施されない 【O/W係数】0.7 (11) 0.92 [1-オクタノール水系, pH6] (1) 【pKa】7.8 (1)

【最大効果発現時間】300mg/日、17週間投与で血清T3, T4が正常化

【更新日】20200820

※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。