

◎プレドニン錠, ◎プレドニゾロン錠・△散 [内], ◎水溶性プレドニン [注]

【重要度】 【一般製剤名】内服:プレドニゾロン (U) 注射:プレドニゾロンコハク酸エステルナトリウム (U) prednisolone/prednisolone sodium succinate 【分類】 合成副腎皮質ホルモン製剤

【単位】◎5mg/錠 [プレドニン], ◎1mg/錠 [プレドニゾロン], △散1%, ◎10mg/A

【常用量】■内服5~60mg/日■注射1回4~100mg [添付文書参照]

【用法】■内服:分1~4■注射:点滴静注, 静注, 筋注 (その他多くの用法あり)

【透析患者への投与方法】減量の必要ないが (6) 透析患者の消化管は脆弱であるため, 消化管出血・潰瘍形成などに十分留意 (5) 【その他の報告】腎不全では代謝障害により半量でよい (J Clin Endocrinol Metab 60: 848-854, 1985) 減量も選択肢 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (3,12)

【特徴】ヒドロコルチゾンに比しグルココルチコイド作用が4倍に増強し, 逆にミネラルコルチコイド作用は0.8倍に減弱。作用時間も長く, 現在最も一般的な合成副腎皮質ステロイドとして多用されている。ベタメサソンの約1/10の活性を持つ。主な生理作用は抗炎症作用、抗体産生抑制、異化促進、リンパ球障害、血管収縮、気管支拡張である。

【主な副作用・毒性】誘発感染症、感染症の増悪、続発性副腎皮質機能不全、消化管潰瘍、消化管穿孔、消化管出血、創傷治癒障害、肺炎、精神変調、うつ状態、痙攣、血栓症、高血圧、心筋梗塞、脳梗塞、動脈瘤、アナフィラキシー様反応、喘息発作の増悪、糖尿病、神経障害、Cushing 様症状、ミオパシー、骨粗鬆症、白内障、緑内障、大腿骨頭壊死、副腎皮質機能不全、臍断裂、幻覚 (スルピリドが効果的)。長期投与で記憶力、注意力の減退、痴呆症状

【安全性に関する情報】肝 CYP3A4 活性の低下は大腿骨骨頭壊死のリスク因子 (Kaneshiro Y, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 396-402, 2006)

【モニターすべき項目】血糖、尿糖、GTT、成長・発達 (青少年)、視床下部下垂体副腎 axis 機能検査、眼科的検査、血清電解質濃度、便潜血

【吸収】速やか (11)

【F】80% (10) 健常者で70~80%だが病態によって変化する (11) 73~100% (14) 82±13% (1)

【tmax】内服1~2hr (11)

【代謝】肝で急速に代謝。腎やその他の臓器でも代謝を受ける (1) 一部はCYP3A4で代謝され, 6β-水酸化体に変換 (1)

【排泄】非活性代謝物として腎から排泄 (U) 尿中未変化体排泄率20%以上 (1) 5~20% (14) 34% (12) 少量の20β-ジドロプレドニゾロン, 20β-ジドロプレドニゾン, ヒドロコルチゾンが尿中に回収 (1) 【CL】100mL/min (1) 105~250mL/min (10) 透析患者で66mL/min (1) 【非腎 CL/総 CL】100% (10)

【t1/2】3.6hr (10) 2.1~3.5hr (U) 2.3~2.8hr (14) 2.5~3.5hr (12) 腎不全患者・肝疾患患者で延長する (J Clin Endocrinol Metab 60: 848-854,1985) エステルとして30min (1) 【透析患者のt1/2】4.7hr (1) 3~5hr (2) 2.2hr (6) 3hr (8) 腎機能正常者と同じ (12)

【蛋白結合率】90~95% (1) 70~95% [飽和する] (6) 80% (12) 90~95% (8) 70~90%, アルブミン、コルチコバインディンググロブリンと結合する (11)

【Vd】0.4~1.3L/kg (10) 0.3~0.7L/kg (6) 0.48L/kg (3) 30~44L/man (11) 0.33L/kg (14) 2.2L/kg (12) 26L/man [iv] (1)

【MW】360.44

【透析性】体内動態に変化なし (1) 5~10% (4) 7~17.5% (Lam YW, et al: Clin Pharmacokinetics 32: 30-57,1997) 【透析 CL】76mL/min (3)

【TDM のポイント】有効治療域0.1~0.4μg/mL (14) 簡便な測定法がないため一般的にTDMは行われていない。Vdが小さく蛋白結合が飽和しやすいためバルプロ酸型の非線形薬物動態を示す (13) 【OW 係数】高い (11) 35.48 [1-オクタノール/buffer, pH7] (1)

【相互作用】リファンピシンの併用によりプレドニゾロンのt1/2は1.4hrに短縮しAUCは総濃度で48%, 遊離型濃度で57%低下 (11, McAllister WAC, et al: BMJ 286: 923-925, 1983) リファンピシン併用によりPSL静注時のAUCが28~48%低下し, 半減期が40~45%短縮 (Lee KH, et al: Eur J Clin Pharmacol 45: 287-289,1993, Powell-Jackson PR, et al: Am Rev Respir Dis 213:339-343,1983)

【最大効果発現時間】1~2hr

【効果持続時間】1.25~1.5日、作用持続時間は臓器内の生物学的半減期に依存する。

【備考】急性心筋梗塞直後に投与された場合に心破裂をおこすことがある。長期、あるいは大量投与中の患者、投与中止後6ヶ月以内の患者では免疫能低下のため生ワクチンは禁忌 (1)

【更新日】20170123

※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。