

◎ユリノーム錠 [内]

【重要度】★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】ベンズブロマロン benzbromarone 【分類】尿酸排泄薬

【単位】▼25mg・◎50mg/錠

【常用量】■痛風：25～50mg/日，維持量50～150mg/日■高尿酸血症を伴う高血圧症：50～150mg/日

【用法】分1～3

【透析患者への投与方法】高度の腎障害のある患者では禁忌 (1)

【その他の報告】無効のため投与しない (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr, eGFR 30mL/min/1.73m²以下または血清クレアチニン値 2.0mg/dL以上の腎障害患者では原則アロプリノールを選択する (高尿酸血症・痛風の治療ガイドライン第2版,2010)

【その他の報告】Ccr>50mL/min：減量の必要なし，Ccr 10～50mL/min：減量の必要ないが Ccr 30mL/min以下では効果が減弱するため投与しない，Ccr<10mL/min：無効のため禁忌 (5)

【特徴】遠位尿細管における尿酸分泌後の再吸収を阻害することにより尿酸排泄作用を示す。遠位尿細管に作用するため軽度の腎機能障害例でも使用できるが，Ccr 50mL/min以下では効果が現れにくくなり，重度の腎障害では無効である。近位尿細管の管腔側に存在し，尿酸の再吸収に関与しているトランスポータ (URAT1) を阻害することにより尿酸の再吸収を低下させ尿酸排泄を促進する。ベンズブロマロン及び6-ヒドロキシ体が活性体。

【主な副作用・毒性】肝障害，消化器症状，発疹，紅斑，かゆみ，光線過敏症，頭痛，浮腫など。

【安全性に関する情報】劇症肝炎等の重篤な肝障害が主に投与開始6か月以内に発現し，死亡等の重篤な転帰に至る例も報告されているので，投与開始後少なくとも6ヶ月間は必ず，定期的に肝機能検査を行う。投与開始後6か月以降も定期的に肝機能検査を行う。副作用として肝障害が発生する可能性があることをあらかじめ患者に説明するとともに，肝機能障害に関連する初期症状があらわれた場合には，服用を中止し，直ちに受診するよう患者に注意を行う (1) 腎結石のある患者には禁忌 (1) 血中尿酸低下作用が強力であり，投与初期に痛風発作を誘発することがある (1)

【tmax】2～3hr，100mg投与後のCmaxは1.84mg/L (Ferber H, et al: Eur J Clin Pharmacol 19: 431-435,1981) 2.7hr (1) 4.8hr [6-水酸化体] (1)

【代謝】主要代謝物はbenzaron (Ferber H, et al: Eur J Clin Pharmacol 19: 431-5,1981) 主として肝代謝酵素CYP2C9によって代謝され，CYP2C9の阻害作用を持つ (1) 未変化体および代謝物の消失には個人差がありおそらく肝代謝酵素の遺伝的欠損が関与 (Walter-Sack I, et al: Eur J Clin Pharmacol 39: 577-81, 1990 PMID: 2095343) CYP2C9*3のホモでは未変化体のクリアランスが低下 (Uchida S, et al: Drug Metab Pharmacokin 25: 605-10, 2010 PMID: 20962433)

【排泄】主に肝および胆汁から消失。尿中にはbenzaron ノグルクロン酸抱合体として投与量の1.55%が排泄 (Ferber H, et al: Eur J Clin Pharmacol 19: 431-5,1981 PMID: 7250176) 尿中に未変化体は回収されない (1) 6-ヒドロキシ体として1.2%が尿中に回収 [po, 72hr まで] (1)

【CL/F】計算上6.25L/hr (5)

【t1/2】2.77hr，代謝物benzaronは13.5hr (Ferber H, et al: Eur J Clin Pharmacol 19: 431-5,1981 PMID: 7250176) 未変化体5.4hr，6-水酸化体18.0hr (1)

【蛋白結合率】96.3～98.3% (1)

【Vd】資料なし (1)

【MW】424.08

【透析性】資料なし (1) 蛋白結合率が高いため透析では除去さおにくいと思われる (5)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない

【薬物動態】投与後5～6時間で最高血中濃度に達し，尿酸排泄効果は24～48時間持続する

【O/W係数】有機相に分配 (1) 【pKa】5.17 (1)

【相互作用】ワルファリンの代謝を阻害することにより，ワルファリンの作用を増強することがある。抗凝固作用の強いS体のワルファリンを特に阻害しやすい (ベンズブロマロンのCYP2C9阻害による)。CYP2C9の基質であり阻害剤である (1)

【主な報告】ラジカルスカベンジにより抗酸化作用をもたらす可能性 (Kadowaki D, et al: Biol Pharm Bull 38: 487-92, 2015 PMID: 25757933) 痛風患者での100から200mg/日に増量しSUAターゲット値の達成率が52%から78%に上昇 (Reinders MK, et al: Ann Rheum Dis 68: 892-7, 2009 PMID: 18633127)

【最大効果発現時間】4～10hr

【効果持続時間】24hr以上

【備考】初期投与量が多いと急激な血清尿酸値の低下とそれに伴う痛風発作を来すことがある。尿が酸性だと尿酸結石が起りやすいので水分の摂取 (尿量の増加) 尿アルカリ化剤の投与を行う [酸・塩基平衡に注意]。尿路結石の既往ない合併がある場合はアロプリノールを選択する (高尿酸血症・痛風の治療ガイドライン第2版,2010)

【更新日】20200330

※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。