

○リマチル錠 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】ブシラミン Bucillamine 【分類】抗リウマチ剤

【単位】▼50mg・○100mg/錠

【常用量】1回100mg, 1日3回 [維持量100~300mg/日]

■安全性を考慮して100mg/日から開始して200mg/日までの増量にとどめる低用量維持療法が行われている

【用法】分1~3

【透析患者への投与方法】透析症例ではブシラミンのt1/2は1.2hrとあまり延長しないが、活性代謝物SA981は9.3hr, SA679は24.4hrと著明に延長するため週3回透析後に1回100mg (透析会誌 27: 1505-10,1994)

活性代謝物の半減期の2倍を投与間隔として, HD後に100mgとすると蓄積性はない(秋山雄次: 日臨免疫会誌 34: 485-491, 2011)

【保存期CKD患者への投与方法】ネフローゼ症候群など重篤な腎障害が現れることがあるため禁忌 (1) 腎障害の既往のある患者には慎重投与 (1)

【特徴】分子内に2つのSH基を有するシステイン誘導体, RAの免疫学的パラメーターの異常を改善し, サプレッサーT細胞構成比率の正常化, RFの改善, γ -グロブリンの減少, CRPの改善などの作用がある。関節腫脹, 赤沈値も改善し, 比較的早期で症状と炎症反応が中等度以上の症例が適応。効果発現まで1~3か月かかる場合がある。

【主な副作用・毒性】ショック, アナフィラキシー, SJS, TEN, 皮疹, 天疱瘡様皮疹, 過敏症, 口内炎, 味覚異常, 消化器症状, 再生不良性貧血, 血小板減少, 好酸球性肺炎, 肺線維症, 間質性肺炎, 顆粒球減少症, 汎血球減少症, 肝機能障害, SJS・TEN, 紅皮症型皮疹, 筋力低下, 女性化乳房など。

【安全性に関する情報】膜性腎症の原因薬として最多 (Yokoyama H, et al: Clin Exp Nephrol 2016 PMID: 265909491) 腎生検による腎症10例の経過 [蛋白尿を認めたらすぐに中止] (Obayashi M, et al: Clin Exp Nephrol 2003 PMID: 14712356) 腎症発症から薬剤中止にて3~85か月後に回復 [中止が治療] (Hoshino J, et al: Nephron Clin Pract 2006 PMID: 16685139) イエローネイル症候群の2例 (Nakagomi D, et al: Rheumatol Int 2013 PMID: 22090009)

【モニター項目】副作用のモニターのため, CBC, 尿検査, 腎機能, 肝機能, 胸部X線検査を定期的実施 [投与前と投与後月1回] (1)

【吸収】食事の影響を受ける可能性 [ラット] (1) 消化器症状のため食後投与に設定 (1)

【F】100% [ラット] (1)

【tmax】1hr (1)

【代謝】ブシラミンのアシル部分のスルフヒドリル基がS-メチルトランスフェラーゼによりメチル化されてモノメチル体SA679が生じ, 次いでシステイン部分のスルフヒドリル基がメチル化されてジメチル体SA672が生じる経路と, ブシラミンのスルフヒドリル基が酸化されて分子内ジスルフィド体SA981が生成する経路があると考えられている (1) 分子内ジスルフィド体は未変化体と同等の活性あり (1)

【排泄】尿中に未変化体と代謝物を合わせて40%が排泄 [24hrまで] (1) 胆汁中に26.1%排泄され, 1.8%が腸管循環 [ラット] (1)

【t1/2】1hr (1)

【蛋白結合率】70% (1)

【Vd】資料なし (1) BBBを通過しない (1)

【MW】223.31

【透析性】ブシラミン, 代謝物とも透析される (透析会誌 27: 1505-10,1994) 資料なし (1)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない 【OW係数】0.09 [1-オクタノール水系, pH7] (1) 【pKa】2.91, 8.15, 9.80 (1)

【主な臨床報告】抗酸化作用等にてシスプラチンの聴覚毒性を抑制する可能性 [マウス] (Kim SJ, et al: Exp Mol Med 2015 PMID: 25697147)

【備考】SH基由来のにおいのため糖衣錠となっている。粉碎不可。

【更新日】20240924

※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。