

◎ロカルトロールカプセル [内], ◎ロカルトロール注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】カルシトリオール (U) Calcitriol 【分類】活性型ビタミンD3製剤

【単位】◎0.25 $\mu$ g・◎0.5 $\mu$ g/Cap, ◎0.5 $\mu$ g・1 $\mu$ g/A [1mL]

【常用量】■内服: 0.25~2.0 $\mu$ g/日■注射: 1回 0.5~1.5 $\mu$ gを透析終了時にできるだけ緩徐に静脈内投与 (週3回)

【用法】■内服: 分1~2■注射: 週2~3回透析終了時に静注 (i-PTHが150pg/mL以下に低下した場合は減量または休薬 (1))

【透析患者への投与方法】■内服: 1日1回 0.25~0.75 $\mu$ g, 二次性副甲状腺機能亢進症には1日1回 0.5~2.0 $\mu$ g服用 (1) パルス療法では4~6 $\mu$ gを週2回服用する (Nephron 57: 23-28,1991) 食後服用がベター (5)

■注射: 1回1 $\mu$ gを週2~3回, 透析終了時にできるだけ緩徐に静注. 以後はPTH及び血清Caの十分な管理のもと, 1回0.5 $\mu$ gから1.5 $\mu$ gの範囲内で適宜増減し, 週1~3回, 透析終了時にできるだけ緩徐に投与 (1) 注射剤を用いる場合は誘導体を含む他のビタミンD剤の併用はしない (1)

【その他の報告】同じ経口投与量を1回/週, 2回/週, 3回/週で投与した3群で比較するとi-PTHは投与回数が多いほど有意に低下する (Manni M, et al: Am J Nephrol 20: 443-447, 2000)

【保存期CKD患者への投与方法】■内服: 減量の必要なし (5)

■注射: 保険適応なし (1)

【特徴】小腸におけるCa吸収の促進、骨吸収と骨形成の調節、腎尿細管でのCa再吸収の増加などの作用がある。副甲状腺細胞のVD受容体に作用しPTHの合成・分泌を抑制する。このことから二次性副甲状腺機能亢進症に対してパルス療法する事によりBAPやintact PTHが低下する (Nephron 77: 267-272, 1997)。静注製剤を二次性副甲状腺機能亢進症に投与することにより貧血が改善し、エリスロポエチン投与量を減量できたという報告がある (Nephron 78: 23-27,1998)。経口パルス療法よりも静注パルスが骨密度の増加作用に優れる (Nephron 90 :188-194,2002) という報告がある一方で、2 $\mu$ gを透析後に静注、経口投与しても透析患者の二次性副甲状腺機能亢進症には静注パルス、経口パルス療法間に効果の差は認められなかった (Levine BS, et al: J Am Soc Nephrol 4: 488-496,1996) という報告もある

【主な副作用・毒性】消化器症状、いらいら、不眠、動悸、肝機能低下、腎機能低下、皮膚掻痒、結膜充血、関節周囲の石灰化、多尿 (VD3投与による高Ca血症のため) など

【モニターすべき項目】Ca, リン, 腎機能, 骨回転

【吸収】小腸から容易に吸収される。VDの代謝物のいくつかは胆汁より再吸収されることが証明されているが無視してよい程度である (U) ほぼ100% (11)

【F】61%以下 (13)

【tmax】経口: 約3~6hr (U,13) 【Cmax】60ng/kg単回投与時のCmaxは460pg/mL以下、同量の経口投与時のCmaxは90pg/mL以下 (13)

【代謝】肝代謝されるが、分解は腎でも部分的に行われる (U) 肝臓と腎臓で代謝されると推定 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率10%以下 (13) 0% (1) 尿中回収率15.8% [iv, 6日後まで] (1)

【CL】0.43mL/min/kg (13) 0.6L/hr [iv] (1)

【t1/2】12~16hr (1) 3~6hr (U) 16.2hr (2) ~24hr (11) 16.5hr (13) 【透析患者のt1/2】16.2hr (2) 21.9hr (1)

【蛋白結合率】88~95% (6) 90%以上 (11) 輸送のために特異なアルファグロブリンと結合する (U) 99.9% (13)

【Vss】10~15L/man [iv] (1)

【MW】416.64

【透析性】透析で除去されない (1)

【O/W係数】高い (11) 19.24 [1-オクタノール/buffer, pH7.4] (1)

【主な報告】副甲状腺への作用に関する分子機構 (Xiang Z, et al: Front Pharmacol 2022 PMID: 36267284)

2型DMのCKDG3への投与は血中CTX, OCN, PINP, i-PTHを低下 (Stathi D, et al: Bone 2023 PMID: 36216304)

効力比として、マキサカルシトール:カルシトリオール=1:7 (安藤亮一, 他: 透析会誌 36: 317-325, 2003)

【効果発現時間】Caの上昇: 経口で2~6hr (U)

【効果持続時間】経口投与後3~5日 (U)

【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。