

△ロレルコ錠・▼シンレスタール錠・▼細粒 [内]

【重要度】 【一般製剤名】プロブコール (U) Probuco 【分類】高脂血症治療剤

【単位】△250mg/錠・▼細粒50%

【常用量】500mg/日 [家族性高コレステロール血症では最大1000mg/日]

【用法】分2

【透析患者への投与方法】おそらく減量の必要なし (5)

【その他の報告】不明 (3)

【保存期CKD患者への投与方法】常用量 (3,12)

【その他の報告】DM性腎症患者の腎機能低下進行を抑制する可能性 (Endo K, et al: J Atheroscler Thromb 2013 PMID: 23363981)

【特徴】ビスフェノール系化合物で血清総コレステロールを低下させる。LDL 異化率亢進作用とコレステロールの胆汁中への異化排泄促進作用及び合成阻害作用 (初期段階) が想定されている。コレステロールトランスポータの ABCA-1 の抑制により HDL も低下する。スタチンに認容性がない場合やスタチンとの併用で IIa 型に適用される。慢性腎障害に対する蛋白尿減少効果が報告されている (腎と透析 35: 289-292,1995)

【主な副作用・毒性】心室性不整脈, 失神, 消化管出血, 横紋筋融解症, 末梢神経炎, 血球減少, 肝機能障害, 下痢, 食欲不振, QT 延長, 味覚異常, 倦怠感, めまい, 頭痛など

【モニターすべき項目】血清コレステロール, 血清トリグリセリド, ECG (U) 心電図上 QT 延長, 心室性不整脈の報告があるので, 投与中は定期的に心電図を評価 (1)

【吸収】胃腸管からの吸収は限られており, 変動が大きい (約 7%) (U) 脂溶性が高いが吸収は悪い 10%以下だが, 食物の存在下で吸収率は上昇する (11)

【tmax】18hr (1)

【代謝】肝で代謝され, 尿中の代謝産物はジェフェノキノン (1)

【排泄】胆汁 (糞便中にゆっくと) ごく少し腎 (主に未変化体) (U) ほとんど胆汁排泄を介して糞便中に排泄され, 腎排泄は無視できる (11) 尿中未変化体排泄率 2%未満 (12) 糞便中に 84%, 尿中に 1.9%排泄 (1)

【t1/2】2~500hr 以上の範囲があり, 脂肪組織における半減期が最も長い (U) 1100hr (10) 150~98hr (2) 23~47 日 (12) 50~98hr (1)

【蛋白結合率】アルブミンとは結合しないが LDL 中に取り込まれる (11) 水に不溶性のため測定不能 (1)

【分布】長期治療により, 脂肪組織 (ほとんどが比重 1.21 以下のリポ蛋白) に蓄積する (U) 脂肪組織に蓄積するため, 投与中止後 6 ヶ月間ゆっくと胆汁に排泄される (11)

【MW】516.84

【透析性】組織移行性が高く, 除去されないと思われる (5) 除去されない (1)

【TDM のポイント】TDM の対象にはならない。通常投与量では 10~数 10µg/mL の血中濃度 【薬物動態】血漿濃度はゆっくと上昇し, 3~4 ヶ月後に定常状態に達する; 投与中止後はゆっくと低下し, 6 週間後には 60%, 6 ヶ月後には 80%低下する (U) 【pKa】13.5 (1) 【O/W 係数】資料なし (1)

【相互作用】シクロスポリンの血中濃度低下 (1)

【最大効果発現時間】血漿コレステロール濃度の最大の減少は, 通常プロブコール療法開始後 20~50 日後に現れる。しかし, 更なる減少は数カ月を超えて現れるかもしれない。臨床的な反応は通常 1~3 ヶ月以内に現れる (U)

【更新日】20230406

※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。