

◎キネダック錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エパルレストット epalrestat 【分類】 糖尿病性末梢神経障害治療剤

【単位】 ◎50mg/錠

【常用量】 150mg/日 [12週で効果がない場合は中止]

【用法】 分3 (食前)

【透析患者への投与方法】 データがないが、常用量投与しても顕著な副作用は見られないことから減量の必要性はないものと思われる (5) 【PD】 常用量 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【特徴】 アルドース還元酵素を特異的に阻害することによりソルビトールの細胞内蓄積を抑制する。それにより末梢神経障害における自覚症状及び神経機能異常を改善する。糖尿病性腎症では高血糖によりアルドース還元酵素の発現が亢進している (Kidney Int 60: 211-8, 2001)

【主な副作用・毒性】 肝障害, 血小板減少, 消化器症状, めまい, こわばり, 四肢疼痛, 動悸, 脱毛, 紫斑, 浮腫, 黄褐色又は赤色の着色尿など

【安全性に関する情報】 肝障害は投与開始1か月以内に多い (1)

【F】 90% [ラット] (1)

【tmax】 1hr (1)

【代謝】 ベンゼン環の4位が水酸化を受け mono-OH 体となり, ついで mono-OH 体の一部は3位がさらに水酸化を受け di-OH 体となる (1) 尿中回収物はベンゼン環が水酸化を受けた一水酸化体及び二水酸化体の硫酸抱合体 (1) 肝 CYP4A11 が代謝に関与 (1)

【排泄】 主として胆汁中排泄 (1) 尿中回収率 19% (1) 尿中には代謝物の硫酸抱合体が排泄 (1) 【CL】 資料なし (1) CL/F=130mL/min [po, 単回投与時の AUC より] (5)

【t1/2】 1hr (10) 1.8hr (1)

【蛋白結合率】 90% (1)

【Vd/F】 データなし (1) 単回投与成績より約 20L/man (1)

【MW】 319.40

【透析性】 HD, PD とも除去されない (1)

【TDM のポイント】 赤血球ソルビトールを測定すれば薬効の判定が可能であるが血漿濃度を測定する必要はない。ヒト赤血球を用いたソルビトール含量抑制効果の IC50 値から有効濃度は 500ng/mL 以上と推定 (1) 【O/W 係数】 18 [1-オクタノール水系, pH7] (1) 【pKa】 4.3 (1)

【備考】 投与対象は HbA1c (NGSP 値) 7.0%以上

【更新日】 20150806

※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。