

△ベザトールSR錠 [内]

【重要度】★★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】ベザフィブラート Bezafibrate 【分類】高脂血症治療剤

【単位】▼100mg・△200mg錠 [徐放錠]

【常用量】400mg/日 ■高齢者では少量から開始

【用法】分2

【透析患者への投与方法】透析患者では横紋筋融解症があらわれることがあるため禁忌 (1)

【その他の報告】200mg/3日に減量し、クレアチンキナーゼをモニターすること (3, Grutzmacher P, et al: Klin Wochenschr 64: 910-6, 1986)

【PD】禁忌 (1)

【保存期 CKD患者への投与方法】Scr 2.0mg/dL以上の患者は禁忌 (1) Scr 1.5~2.0mg/dL未満 (Ccr 50~60mL/min) : 200mg/日 (1)

【その他の報告】GFR>50mL/min : 50~100%, GFR 10~50mL/min : 25~50%に減量, GFR<10mL/min : 避ける (12)

Ccr>50mL/min : 常用量, Ccr 10~50mL/min : 50~70%に減量, Ccr<10mL/min : 10~30%に減量 (10)

GFR 10~50mL/min : 50%に減量し 24~48hr 毎, GFR<10mL/min : 避ける (3)

50<Ccr<60, 1.5<Scr<2 : 1日 200mg を1回 (18)

15<Ccr<59mL/min : 25%に減量, Ccr<15mL/min : 避ける (K/DOQI/AJKD 41:suppl 3, 2003)

腎障害患者への投与は軽度な骨格筋傷害による腎機能低下に関連する可能性がある (Charach G, et al: Nephron 100:c120-5, 2005)

フィブラート投与は腎血行動態の変化から腎障害を惹起する可能性がある (Lipscombe J, et al: Clin Nephrol 55: 39-44, 2001)

Ccr 20~40mL/minの患者で半減期が7.8hr, Ccr 13mL/minの患者で半減期が20hrに延長するので腎機能により用量調節すべきである (Anderson P, et al: Eur J Clin Pharmacol 21: 209-14, 1981)

【特徴】クロフィブラートの誘導体で徐放性化されており、1日2回の投与で有効。核内受容体PPAR- α のリガンドで、PPAR- α を活性化させる。高TG血症、III型に適用される。TCとLDL-Cの低下やHDL-Cの上昇作用もある。

【主な副作用・毒性】横紋筋融解症、肝障害、SJS、アナフィラキシー、傾眠、不眠、頭痛、めまい、筋肉痛、消化器症状、光線過敏症、肝機能障害、腎機能障害、胆石、勃起不全、味覚異常、発熱、浮腫、頻尿、脱毛など

【安全性に関する情報】CKD患者で投薬を中止するとおよそ半数の例でeGFRが上昇 [TGも上昇] (Zingerman B, et al: Sci Rep 2020 PMID: 33188240)

【モニターすべき項目】クレアチンキナーゼ

【F】ほぼ完全に吸収される [尿中回収率より] (1)

【tmax】4.5hr (1)

【代謝】代謝物の活性はなし (11) 尿中代謝物として水酸化体、グルクロン酸抱合体などが存在 (1)

【排泄】尿中回収率69.1% [po, 48hrまで] (1) 尿中未変化体排泄率20% (10) 50% (12) 47% (11) 尿中回収率94%, 糞便中回収率3% (11)

【CL】133mL/min (10) 資料なし (1) 【非腎CL/総CL】15% (10)

【t1/2】2.5~3.5hr (1) 1.7hr (10) 0.87~4.82hr (11) 2.1hr (12) 【透析患者のt1/2】5~9hr (10) 8~20hr (12)

【蛋白結合率】95% (10,12) 94% (1)

【Vd】0.28L/kg (10) 17L/man (11) 0.24~0.35L/kg (12) 資料なし (1)

【MW】361.82

【透析性】蛋白結合率が高いため透析で除去されにくいと思われる (5) 資料なし (1) 横紋筋融解症に対して血漿交換を行うと除去された (Yang KC, et al: Am J Kidney Dis 45: e57-60, 2005)

【TDMのポイント】TDMの対象にはならない【OW係数】資料なし (1)

【相互作用】スタチンとの併用は横紋筋融解症のリスクより腎障害患者で特に注意 (1) ワルファリンの作用増強 (1) フルバスタチンの血中濃度上昇 [肝代謝阻害によるFPE低下による] (1) 特に高齢者でSU剤、ナテグリニドの血糖降下作用増強 (1) インスリン感受性増強によるインスリンの作用増強 (1) シクロスポリン : 腎障害の増強 (1) コレスチラミン : 2hr以上あけて投与 (1) レバグリニドとの相互作用を認めない (Kajosaari LL, et al: Br J Clin Pharmacol 58: 390-6, 2004)

【効果持続時間】10.8hr (1)

【備考】腎機能が正常ならスタチンとフィブラートの併用でも副作用頻度は上昇しない (N Engl J Med 362: 1563-74, 2010)

【更新日】20220921

※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などでご確認ください。

※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。