

▼レリフェン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ナブメトン (U) Nabumetone 【分類】 非ステロイド性抗炎症薬

【単位】 ▼400mg/錠

【常用量】 800mg/日

【用法】 1日1回 [食後]

【透析患者への投与方法】 常用量 (17)

【その他の報告】 6-MNA の排泄が延長するが、Vd の変化で相殺されるため減量の必要なし (11, Brier ME, et al: Clin Pharmacol Ther 1995 PMID: 7781261) 減量の必要なし (17)

【PD】 データなし (17)

【CRRT】 できれば避ける (17)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 重篤な腎障害患者には禁忌 (1)

【その他の報告】 腎障害悪化の恐れがあるためできるだけ投与しない (5) GFR 50mL/min 以下 : 50~100%量 (17)

蛋白結合率の変化により代謝物を含めた PK は変動するが減量の必要はない (Brier ME, et al: Clin Pharmacol Ther 1995 PMID: 7781261)

【特徴】 経口投与後体内で速やかに変換された活性代謝物がプロスタグランジンの生合成阻害作用を有し強力な抗炎症・鎮痛作用を示すプロドラッグ。作用時間が長く胃粘膜障害が軽度。

【主な副作用・毒性】 ショック・アナフィラキシー、SJS・TEN、間質性肺炎、ネフローゼ症候群、腎不全、肝障害、発疹・掻痒、胃部不快感、悪心・嘔吐、心窩部痛、下痢、浮腫など

【安全性に関する情報】 間質性腎炎の症例 (Blackwell E, et al: Pharmacotherapy 1995 PMID: 8570441)

【吸収】 消化管で 80%以上、食事摂取による影響がないが牛乳により吸収増加 (11) ゆっくり吸収される (U)

【F】 活性体 6-MNA として 38% (11) 35% (13)

【tmax】 4.0±1.8hr (1)

【代謝】 全身循環達するまでに肝でほぼ 100%代謝され活性体 6-MNA となり、さらに種々代謝される (11) 酸化・還元・脱メチル化及び抱合をうけ代謝される (1) 未変化体活性はない (U)

【排泄】 尿中活性体排泄率 1%以下 (13) 6-MNA として 2.32% [po, 72hr まで] (1) 尿中回収率 77%, 9%が糞便中排泄 [72hr まで] (1) 尿中回収率 80% [未変化体は検出限界以下、6-MNA の尿中排泄率 1%以下], 糞中 6-MNA として 10%以上 (11) 6-MNA の排泄は腎障害時にやや遅延する (U)

【CL】 6-MNA : 0.37mL/min/kg (13)

【t1/2】 800mg 投与時 20.5±2.2h (1) 23hr, 腎障害により延長 (13) 活性体 6-MNA 23±3.7hr (U) 高齢者では 30hr (U) 腎障害患者で 39hr (U)

【蛋白結合率】 99%以上 [6-MNA] (11) 99%以上、血漿濃度上昇に伴い遊離型分率は 4~5 倍上昇するため、蛋白結合率も 0.05 μg/mL では 99.8%であるが 100 μg/mL では 99.2%に低下する (13)

【Vd】 6-MNA : 7.5L/kg (11) Vd/F : 6-MNA : 0.79L/kg (13)

【MW】 228.3

【透析性】 6-MNA の蛋白結合率が高いため透析では除去されにくいと考えられる (13) 資料なし (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない 【O/W 係数】 高い (11) 1500~1600 [1-オクタノール水系] (1) 【薬物動態】 常用量が 800mg と多く、Vd が小さく蛋白結合率が非常に高いため、用量依存的に CL、Vd が上昇し、総濃度が上昇しにくくなるパルプロ酸型の非線形薬物動態を示す (13)

【更新日】 20241009

※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。