

○注射用エラスポール [注]

【重要度】 【一般製剤名】 シベレスタットナトリウム水和物 sivelestat sodium hydrate 【分類】 好中球エラスターゼ阻害剤

【単位】 ○100mg/V

【常用量】 4.8mg/kg/日 (0.2mg/kg/hr) [生食で溶解後、生食、5%ブドウ糖、ソリタ輸液等で希釈]

【用法】 250～500mLに希釈し24hr持続静注。肺障害発生後72hr以内に投与を開始することが望ましく、14日以内の使用とする [5日後の改善度が低い場合にはその後の改善度も低い] (1)

【透析患者への投与方法】 常用量と同じ (1) CHDFにおいても体内動態に大きな変化なし (1)

【保存期 CKD患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【特徴】 全身性炎症反応症候群 (SIRS) に伴う急性肺障害は好中球エラスターゼが重要な傷害因子である。SIRS では高サイトカイン血症から活性化された好中球が肺に集積し、エラスターゼを遊離し、肺血管内皮細胞や肺胞上皮細胞を傷害し、肺血管透過性を亢進させ、急性肺障害を誘発させるため、好中球エラスターゼを選択的に阻害することで治療効果を発揮する (1)

【主な副作用・毒性】 過敏症、肝障害、白血球減少、好酸球増多、呼吸困難など

【代謝】 肝カルボキシエラスターゼにより加水分解されM-1となりさらにグルクロン酸抱合および硫酸抱合を受け尿中排泄される (1) M-1に活性はない (1) CYPは関与しない (1)

【排泄】 尿中に未変化体は排泄されない (1) 非活性代謝物M-1として80%以上が尿中排泄 (1) 【CL】 13.5mL/hr/kg (1)

【t1/2】 2～10hr (1)

【蛋白結合率】 99.6% (1) 高濃度で低下、アルブミンのビリルビンサイトに結合 (1)

【Vd】 0.084L/kg (1)

【MW】 528.51

【透析性】 蛋白結合率が高いため透析で除去されないと思われる (5) CHDF施行時も用量は同じでよい (1) 代謝物は透析性があるかもしれない (5)

【TDMのポイント】 0.2mg/kg/hr投与時のC_{ss}=5～7μg/mL (1) 【pKa】 5.3, 8.2 (1) 【O/W係数】 0.2 [1-オクタノール/buffer, pH8.0] 12.0 [1-オクタノール/buffer, pH5.4] (1)

【備考】 Caを含む輸液と混合するときは、エラスポールの濃度を1mg/mL以下にする (2mg/mL以上では沈殿する) (1) アミノ酸輸液との混注は避ける (1) Caを含む輸液では溶解しない。酸性条件下で結晶析出 (1)

【更新日】 20140320

※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。