△ケアラム錠　［内］

【重要度】★　【一般製剤名】イグラチモド　Iguratimod　【分類】関節リウマチ治療薬［DMARDs］

【単位】△25mg/錠

【常用量】1回25mg/日［朝］で4週以上経過後に1回25mg，1日2回［朝・夕］に増量

■初期量を50mgとすると肝機能検査値異常の発現率が高いため低用量から開始

■投与前に血液検査，腎機能検査等を実施

■体重40kg未満例では副作用発現率が高いため要注意

【用法】25mg/日は朝食後，50mg/日は朝・夕食後

■通常16週まで投与後に効果を判定

【透析患者への投与方法】副作用の発現が増加するおそれがあるため慎重投与（1）

【保存期CKD患者への投与方法】副作用の発現が増加するおそれがあるため慎重投与（1）

【特徴】クロモン骨格を有する抗リウマチ剤．転写因子 NFκB の活性化を阻害，B リンパ球に直接作用し免疫グロブリン（IgG、IgM）の産生を抑制，単球/マクロファージに作用し，TNFα，IL-1β，IL-6 などの炎症性サイトカインの産生を抑制，などが推測されている．

【主な副作用・毒性】肝障害，血球減少，消化性潰瘍，間質性肺炎，感染症，消化器症状，尿蛋白など．

【安全性に関する情報】副作用の発現率は高いので長期投与時には肝機能検査など副作用の評価を行うべきである（Hara M, et al: Mod Rheumatol 2007 PMID: 17278016）1日125mgを投与した症例で致命的な転帰に至った汎血球減少症が報告（1）

【モニターすべき項目】投与前および投与開始後最初の2ヵ月は2週に1回、以降は1ヵ月に1回など定期的に血液、腎機能等の検査を行う

【吸収】食事の影響を受けない（1）AUCに差はないが，食事でCmax上昇，tmax短縮（Xiao F, et al: Eur J Clin Pharmacol 2018 PMID: 29051989）

【F】95%［ラット］（1）

【tmax】4hr（1）

【代謝】主代謝物はホルミルアミノ基の脱ホルミル体であるM1と，M1のアミノ基がアセチル化されたM2で，いずれも活性がある（1）M1からM2への代謝反応には肝臓のNATが関与（1）代謝には複数のCYPが関与しているが，M1はCYP2E1により生成（1）

【排泄】尿中活性体［未変化体，M1，M2］排泄率1%未満（1）尿中回収率20%で主にM3，M4（1）

【CL】CL/F=40～50mL/min［po］，腎CL=0.04mL/min（1）

【t1/2】10～17hr（1）

【蛋白結合率】93%（1）

【Vd/F】20～26L/body［po］（1）

【MW】374.37

【透析性】資料なし（1）透析性は低いと思われる（5）

【O/W係数】46［1-オクタノール/水系，pH7.0］（1）【薬物動態】2-コンパートメントモデルに適合（1）

【相互作用】ワルファリンの作用増強のため併用禁忌（1）CYP2C9によるワルファリン水酸化を阻害する（Yamaori S, et al: Biol Pharm Bull 2015 PMID: 25757926）
NSAIDs：胃腸障害の発現率の増加（1）ビタミンK依存性血液凝固因子レベルの低下が相互作用機序に関連（Yamamoto T, et al: Yakugaku Zasshi 2016 PMID: 27252068）

【主な臨床報告】SASPと効果や副作用が同等で，他のDMARDs不応例にも8週以内に効果がある（Hara M, et al: Mod Rheumatol 2007 PMID: 17278015）
MTX単独よりも本剤併用の方が効果が高く安全性は同等（Ishiguro N, et al: Mod Rheumatol 2013 PMID: 22833377）
MTXやSASPと効果は同等（Li J, et al: Clin Dev Immunol 2013 PMID: 24371446）
52週のPMS（Mimori T, et al: Mod Rheumatol 2019 PMID: 29611761）
再発性ループス腎炎寛解治療の選択肢になるかもしれない（Kang Y, et al: Arthritis Res Ther 2020 PMID: 32228698）

【備考】

【更新日】20241029

※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、当院では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。