

## ◎ウリアデック錠・▼トピロリック錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 トピロキシスタット Topiroxostat 【分類】 キサンチンオキシダーゼ阻害薬 [非プリン型]

【単位】 ◎20mg・◎40mg・▼60mg/錠

【常用量】 1回 20mg 1日 2回から開始, 血中尿酸値に応じて徐々に増量し, 維持量は1回 60mg 1日 2回 [最大1回 80mg, 1日 2回]

【用法】 分2

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【その他の報告】 アロプリノールやフェブキシスタットからの切り替えでは1日1回投与で効果あり (北野泰佑, 他: 透析会誌 48: S416, 2015)

血中濃度は非透析患者と同じで, 不活性代謝物の血中濃度は高くなるがHDで除去される (大山聡子, 透析会誌 48: S536, 2015)

1日1回20mgからの開始も選択肢 (5)

低用量でも尿酸管理に有効 (Nagaoka Y, et al: Hemodial Int 2018 PMID: 29227568)

40mg/日はフェブキシスタット 10mg/日と同等の効果 (Mitsuboshi S, et al: Biol Pharm Bull 2017 PMID: 28867729)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【その他の報告】 CKD G3 患者に 160mg/日投与すると GFR は変化しないが SUA と尿中アルブミン排泄が有意に低下した (Hosoya T, et al: Clin Exp Nephrol 2014 PMID: 24448692)

【特徴】 非プリン型キサンチンオキシダーゼの選択的・可逆的阻害剤。尿酸値の日内変動を小さくする目的で1日2回投与が設定されている。

【主な副作用・毒性】 肝機能障害, 多形紅斑, 痛風関節炎, 口内炎, 白血球増加, 白血球減少, 四肢痛, 消化器症状など。

【安全性に関する情報】 光毒性はなし (1) QT 延長を起こさない (Sugiyama A, et al: J Clin Pharmacol 54: 446-52, 2014)

メタ解析により肝機能障害のリスク上昇が検出 (Zhang S, et al: Pharmacotherapy 2021 PMID: 34170566)

【F】 79.6% [サル] (1) 尿中回収率より 76.8%以上 (1)

【tmax】 0.67~0.92hr (1)

【代謝】 肝で代謝され, 主代謝物はグルクロン酸抱合体で UGT1A9 が関与 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 0.1%未満 [po, 48hr まで] (1) 尿中にグルクロン酸抱合体として 52.3~59.9%, N-オキサイド体として 4.5~5.3%回収 [po, 48hr まで] (1) 【CL/F】 69±18L/hr (1)

【t1/2】 4.56~7.49hr (1) ke=0.138/hr (1)

【蛋白結合率】 97.5~98.8% [主に Alb] (1)

【Vd】 資料なし (1)

【MW】 248.24

【透析性】 資料なし (1) 透析性は低いと思われる (5)

【O/W 係数】 LogP=1.41 [1-オクタノール/buffer, pH 7.0] (1)

【相互作用】 機序不明であるが, ワルファリンの代謝を抑制して効果増強の可能性 (1) 【併用禁忌】 メルカプトプリン, アザチオプリン (1)

【主な臨床報告】 多くは 40mg/日の低用量でも効果が認められる (日高雄二, 他: 痛風と核酸代謝 39: 91, 2015)

アロプリノールと比較して心不全例での有用性は証明されず (Sakuma M, et al: PLoS One 2022 PMID: 35077456)

40mg/日はフェブキシスタット 10mg よりも尿酸値低下効果が強い (Mitsuboshi S, et al: Biol Pharm Bull 2017 PMID: 28867729)

【備考】 UA は夜間に上昇するので, 分1 の場合は夕食後に投与 (1)

【更新日】 20240814

※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。