△クリノリル錠　［内］＜販売中止＞

【重要度】　【一般製剤名】スリンダク（U）　Sulindac　【分類】非ステロイド性消炎･鎮痛剤
【単位】△100mg・▼50mg/錠
【常用量】300mg/日
【用法】分２食後
【透析患者への投与方法】減量の必要なし．遊離型スリンダク濃度は健常者と同等だが，遊離型および総活性代謝物濃度は健常者よりも低い（J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993）【その他の報告】減量の必要なし（4）50～100%（3）
【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要はないが，腎障害悪化の恐れがあるためできるだけ投与しない（5）【その他の報告】減量の必要なし（ただし常用量の設定 200mg/日）（12）GFR＜50mL/min では 50～100%（3）重篤な腎障害のある患者には投与禁忌，腎障害又はその既往歴のある患者には慎重投与［PG 合成阻害作用により，腎血流量低下及び水，ナトリウムの貯留が起こるため腎障害が悪化（または再発）するおそれがある］（1）
【特徴】プロドラッグであり、胃腸管への良好な忍容性がある。活性体のままでは腎排泄されないため、腎機能に及ぼす影響が少ない。降圧剤との併用でもその降圧効果にほとんど影響を与えない。持続的な抗炎症･鎮痛作用がある。
【主な副作用･毒性】高カリウム血症、急性腎不全、間質性腎炎、ネフローゼ症候群、肝機能障害　（胃腸障害，　腎障害は比較的弱い）、喘息発作誘発、味覚異常など
【モニターすべき項目】BUN、血清 Cr、血清 K、ヘマトクリット、ヘモグロビン、検尿、便潜血、血算、肝機能、眼科検診、上部消化管診断
【吸収】90%（11）
【F】88%以上（10）
【tmax】活性代謝物の tmax は空腹時 2hr、食物摂取後 3～4hr（11）5.3hr（1）sulindac1.7hr、sulindac sulfide7.7hr（13）【Cmax】健常者に空腹時に 300mg 単回経口投与したときの Cmax は sulindac11μg/mL、sulindac sulfide7.7μg/mL（13）
【代謝】肝で活性代謝物 sulindac sulfide になる（U）sulindac sulfide は親化合物の 2～5 倍の活性を持つ（J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993）
【排泄】尿中回収率 50%（U）活性体としての尿中排泄率 1%未満（U）7%（10,12）20%が未変化体および代謝物として尿中排泄（6）胆汁に排泄され腸肝循環する（11）無視できるくらい低い（13）【腎 CL】9.1mL/hr/kg，スルフォン体 3.1mL/hr/kg（1）
【t1/2】■スリンダク 7～8hr（11）7.8hr（U）2 相性で 8hr（4）17hr（6）3hr（13）18hr（6）2.95hr（J Clin Pharmacol 33:527-534,1993）■スルフィド体 16～18hr（11）18hr（10）16hr（4）12.9hr（13）【透析患者の t1/2】スリンダクは 1.98hr，活性体は 15.6hr で正常腎機能者と同じ（J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993）
【蛋白結合率】93%（11）90%（U）95%（12）96%（10）sulindac93.1%、sulfide 代謝物 95.4%、sulfone 代謝物 97.9%（11）sulindac94%、sulindac sulfide94%，腎疾患で低下（13）【腎不全患者の蛋白結合率】腎不全で低下するが透析により上昇する（J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993）
【Vd】2L/kg（1）
【MW】356.42
【透析性】親化合物、活性体ともに除去されない（J Clin Pharmacol 33: 527-534,1993）資料なし（1）
【TDM のポイント】TDM の対象にならない【O/W 係数】0.28（11）0.11［エーテル/水系，pH7.5］，スルフィド体 90［エーテル/水系，pH7.5］（1）【pKa】4.5（1）
【慎重投与】ACE 阻害薬，ARB：腎機能が悪化している患者では，さらに腎機能が悪化するおそれ（1）
【更新日】20240321

※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。