

▼ヘキストラスチノン錠 [内] <製造中止>

【重要度】★ 【一般製剤名】トルブタミド (U) tolbutamide 【分類】経口糖尿病用剤 [SU 剤]

【単位】▼500mg/錠

【常用量】500～1000mg/日 [最大2000mg]

【用法】分1～2

【透析患者への投与方法】代謝物の活性は非常に弱いためグリベンクラミドに比し腎不全患者の低血糖の発症は少ない (Clin Pharmacokinet 31:111-9,1996) ため減量の必要ないが低血糖発作に要注意 (5)

【その他の報告】重篤な腎機能障害のある患者では低血糖を起こすおそれがあるため禁忌 (1) 減量の必要なし (3,4) 代謝物の hydroxy-tolbutamide にも弱い血糖降下作用あり、腎不全では代謝物、未変化体の蓄積により作用時間が延長 (Am J Med Sci 254:608-618,1967)

【保存期 CKD 患者への投与方法】重篤な腎機能障害のある患者では低血糖を起こすおそれがあるため禁忌となっているが減量の必要なし (3,10,12)

【特徴】スルホニル尿素系血糖降下剤。長期投与においても安全性が高いと考えられており血中での代謝が早い。

【主な副作用・毒性】低血糖 (投与中止後であっても数日間は再発に注意)、骨髄抑制、肝機能障害、胃腸障害、皮膚過敏症、エタノール耐性低下、甲状腺機能障害など

【モニターすべき項目】血糖値、CBC、尿糖、尿中ケトン体、HbA1c、血漿浸透圧、血清 Na・K、血清 pH

【F】93% (1) 100% (14) 80～90%、初回通過効果は無視できる (13)

【tmax】3～4hr (U,11) 3.1hr (13) 【Cmax】500mg を単回経口投与した時の Cmax は 53 μg/mL (13)

【代謝】主に CYP2C9 により代謝 (1) CYP2C9 によってメチル水酸化される (U)

【排泄】尿中未変化体排泄率 1%以下 (10,11,13) 0% (12) 1%以下 (U) 非活性代謝物として尿中に 75% (U) 80% (11) が回収される糞中未変化体排泄 9% (11) 【CL】16.6mL/min (10) 1.50mL/min/kg、急性ウイルス性肝炎では上昇 (13)

【t1/2】4.5～6.5hr (U) 4～7hr (10) 4～8hr (11) 4～6hr (12) 7hr (14) 5.9hr、急性ウイルス性肝炎・慢性呼吸器疾患で短縮 (13) 透析患者でも変化なし (10,12)

【蛋白結合率】96% (1,U) 95～97% (12) 95%で濃度依存性に変化する (10) 99.9%以上、急性ウイルス性肝炎・加齢により低下 (13)

【Vd】0.1～0.2L/kg (U,10,11) 0.12L/kg (13) 0.1～0.15L/kg (12)

【MW】270.35

【透析性】透析でほとんど除去されない (4) 資料なし (1)

【TDM のポイント】有効治療域 80～240 μg/mL で血糖値を 25%低下できる (13) 有効治療域 50～100 μg/mL (14) TDM の対象にはならない (5) 【薬物動態】吸収は早く良好だが個人差がある。胃の運動障害や高血糖により吸収が遅延する。食事の影響は受けませんが、高い pH で吸収が良くなる (U) 【pKa】5.43 (1) 【OW 係数】資料なし (1)

【相互作用】他の血糖降下薬と併用注意 (1) CYP2C9 阻害作用を有するフルボキサミン併用によりクリアランスが低下するが、顕著ではない (Clin Pharmacol Ther 69: 41-7, 2001) クラリスロマイシン併用により血糖降下作用が増強し、低血糖症状が起こることがあるため併用注意 (1)

【効果持続時間】6～12hr

【備考】CYP2C9 活性のプロープになる (Lee CR, et al: Clin Pharmacol Ther 72: 562-71, 2002)

【更新日】20180403

※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。