

△ レガレンカプセル [内] <製造中止>

【重要度】【製造中止】 【一般製剤名】 ケノデオキシコール酸 chenodeoxycholic acid 【分類】 胆石溶解剤

【単位】 △100mg/C

【常用量】 300～400mg

【用法】 分2～3

【透析患者への投与方法】 糞便中排泄が主であるため減量の必要はない。(5)

【保存期腎不全患者への投与方法】 減量の必要なし。(5)

【特徴】 天然に存在する胆汁酸の一つ。本剤投与によって相対的に不足した界面活性剤を増加させ、析出した遊離コレステロール(胆石)を清浄作用によって再溶解させる。また肝でのコレステロール合成能を抑制する。300mg/日以下では下痢の発症は少ないが750mgでは50%に下痢が出現する。

【主な副作用・毒性】 肝障害、下痢、発疹

【吸収】 完全に吸収される (Clin Pharmacokinet 30: 333-358, 1996)

【F】 250mg、500mgの投与量では完全。750mgでは81% (Eur J Clin Invest 10: 261-271, 1980)

【tmax】 1～2hr

【代謝】 肝で初回通過効果を受ける。肝でタウリン抱合、グリシン抱合体になり、抱合体は胆汁に分泌され、内因性胆汁酸とともに腸肝循環する。腸内細菌により lithocholic acid になり、主に糞便中に排泄される。大部分の胆汁酸が腸肝循環しているため、血中濃度は低い (Clin Pharmacokinet 30: 333-358, 1996)

【排泄】 糞便中排泄 (1) 腎クリアランス 6.4%で主に尿細管分泌による (Clin Sci 61: 773-780, 1981) 腸内細菌により lithocholic acid になり、主に糞便中に排泄される。大部分の胆汁酸が腸肝循環しているため、血中濃度は低いが、重篤な胆汁鬱滞があると腎クリアランスの割合が上昇する (Clin Pharmacokinet 30: 333-358, 1996)

【t1/2】 約 1.5～2hr (経口 300mg)

【蛋白結合率】 96～97% (1) 96.5% (Clin Sci 61: 773-780, 1981)

【Vd】 大部分の胆汁酸が腸肝循環しているため、血中濃度は低く、Vdは大きい。肝疾患では血中胆汁酸濃度が上昇するためVdは低下する (Clin Pharmacokinet 30: 333-358, 1996) 低い (11)

【pKa】 6.18 (1)

【備考】 本剤による胆石溶解は長期にわたり気長に投与する必要がある。一部のものにしか効果がみられないといった欠点があり、各症例にあたっては適応を十分に検討し、投与を続けるべきか外科手術にゆだねるか考慮が必要である。

【更新日】 20150825

※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。