

## ▼ツベルミン錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】エチオナミド (TH) (U) ethionamide 【分類】結核化学療法剤

【単位】▼100mg/錠

【常用量】10mg/kg/日 [最大 600mg] ただし、200mg/日より漸増 (結核診療ガイドライン)

【用法】分1～3

【透析患者への投与方法】50%に減量 (12)

【その他の報告】腎障害のある患者では高い血中濃度が持続するので、投与間隔をあけて使用すること (1) 腎不全患者での薬物動態については報告がない (11) 50%に減量 (3) 250～500mg を1日2回 [HD日はHD後] (17) 尿中未変化体排泄率は低いが、また代謝物に活性があるため薬物動態学的な裏付けはないが、減量の必要があるかもしれない (5)

【PD】250～500mg/日 [分2～3] (17) 減量の必要なし (サンフォード感染症治療ガイド)

【CRRT】15～20mg/kg/日 [分2～4] (17) 減量の必要なし (サンフォード感染症治療ガイド)

【保存期 CKD患者への投与方法】Cr10mL/min以上：減量の必要なし、Cr<10mL/min：50%に減量 (12, サンフォード感染症治療ガイド)

【その他の報告】減量の必要なし (10) GFR 10mL/min以上：常用量, GFR<10mL/min：50%に減量 (3)

Cr 30mL/min未満で250～500mg/日 (Am J Respir Crit Care Med 167: 603-62, 2003)

GFR 10mL/min以上：15～20mg/kg/日 [分2～4], GFR 10mL/min未満：5～10mg/kg/日 [分2～3] (17)

【特徴】イソニアジドの類似化合物でイソニアジド耐性菌に有効。MICは2～4  $\mu$ g/mLで抗菌力はあまり強くない。他の抗結核剤との交差耐性はない。胃腸障害の副作用発現率は約70%と非常に高く肝障害も約5%の頻度で発現する。四肢知覚異常や精神神経症状も発現する。胃腸障害(胃壁刺激による悪心・嘔吐)を軽減する腸溶性フィルムコート錠

【主な副作用・毒性】黄疸などの重篤な肝障害、発疹、食欲不振、悪心、胃痛、下痢等の消化器症状、頭痛、不眠、不安、眩暈、抑鬱、興奮、四肢知覚異常、メラニコリー等の精神神経系症状、甲状腺機能低下、月経異常、ED、女性化乳房、脱毛。エチオナミドの肝毒性はメチマゾールの前投与で低下する (11)

【モニターすべき項目】AST、ALT、眼科学的検査

【吸収】糖衣錠は良好に吸収され、250mg投与後ピーク濃度は2時間後に1.7～2.0  $\mu$ g/mLになるが本剤は腸溶錠のため、吸収は悪く90% (11)

【tmax】4～6hr (1) 腸溶性皮膜をほどこした糖衣錠であるため遅い (1)

【代謝】ほとんどが肝でスルフォキシド化、脱硫化、酸化的脱アミノ化される。エチオナミドスルフォキシドは親化合物と同等の抗菌力を持つ (11) 未変化体は活性型の ethionamide sulfoxide と相互に変換される (1) 尿中に不活性型の 2-ethylisonicotinamide, 2-ethylisonicotinic acid, 無機硫酸塩及びN-メチル体が検出 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率1%以下 (1) 1% (12) 0.16% (11) スルフォキシド代謝物として1.2%が尿中に排泄 (11) 糞便中未変化体排泄率0.1%以下 (11)

【t1/2】2.1 [1.8～2.4] hr (11,12) 2hr (1) 【ESRD患者のt1/2】データなし (12)

【蛋白結合率】30% (1,11,12) 主にAlbと結合するが $\alpha$ 1および $\alpha$ 2グロブリンとも結合 (11,12)

【分布】広く体全体に分布する。脊髄液中濃度は血清遊離型濃度と同等 (11)

【Vd】2.8L/kg (U)

【MW】166.24

【透析性】Vdが大きいため透析で除去されにくいと思われる (5) 透析液排液中に2.1%のみしか回収されない (Malone RS, et al: Chest 116: 984-90, 1999) 資料なし (1)

【TDMのポイント】一般的にTDMは実施されていない

【O/W係数】LogP=0.3699 (1) 【pKa】5.62

【更新日】20180705

※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。