

△ハイペン錠, ▼オステラック錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エトドラク (U) etodolac 【分類】 非ステロイド性鎮痛・抗消炎剤

【単位】 △100mg・△200mg/錠

【常用量】 400mg/日

【用法】 1日2回

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3, Clin Rheumatol 8: S25-S35, 1989)

【その他の報告】 200~300mgを1日2回もしくは頓用で200mgを6~8hrあけて (17)

【PD】 データなし (17)

【CRRT】 消化器障害, 腎障害のリスクから投与を避ける (17)

【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】 重篤な腎障害患者には禁忌, 腎障害又はその既往歴のある患者には慎重投与 [PG 生合成阻害作用に基づく腎血流量低下作用があるため, 腎障害を悪化 (または再発) させることがある] (1)

減量の必要なし (3,12)

GFR 10mL/min 以上:300~500mgを1日2回もしくは頓用で200~400mgを6~8hrあけて, GFR 10mL/min 未満:200~300mgを1日2回もしくは頓用で200mgを6~8hrあけて (17)

【特徴】 ピラノ酢酸系鎮痛消炎剤。選択的COX-2阻害作用により炎症部位でのプロスタグランジンE2生合成を阻害し, 鎮痛消炎作用, ブラジキニン生合成阻害による鎮痛消炎作用を示す。他のNSAIDsに比し胃潰瘍形成作用が弱く, アレルギー反応時の気道系や軟骨のグルコサミノグリカン代謝に対して悪影響を及ぼさない。

【主な副作用・毒性】 ショック, 胃潰瘍穿孔, SJS, 発疹, 掻痒感, 蕁麻疹, 光線過敏症, 消化器症状, 口内炎, 眩暈, しびれ, 頭痛, 腎機能異常, 貧血, 白血球減少症, 発熱, ほてり, 倦怠感など

【吸収】 73%以上 (11) 良好に吸収 (U) Cmaxは食事で50%, 制酸剤で15~20%低下する (U)

【F】 初回通過効果は無視できる (U,11) 吸収は線形 (1)

【tmax】 1~2hr (1) 2~3hr (U) 1.1~1.3hr, 200mg単回投与時のCmaxは15~18 μ g/mL (Clin Rheumatol 8: S25-S35,1989)

【代謝】 肝が主要代謝臓器で20%がグルクロン酸抱合され, その他は水酸化または抱合される。代謝物に活性はない (Clin Rheumatol 8: S25-S35,1989) 肝代謝される (U) CYP2C9により6-OH体, 7-OH体に変換され, それぞれグルクロン酸抱合体となる (1) 未変化体もUGT1A9でグルクロン酸抱合される (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率15~16% [po, 24hrまで] (1) 1%未満 (U) 最初の2時間で約1/2が尿中に回収され, 7日間で73%が尿中に回収されるがその95%以上は代謝物として排泄され尿中未変化体排泄はほとんどない (Clin Rheumatol 8: S25-S35,1989) 尿中回収率73% [po, 168hrまで] (1)

【CL】 54.5mL/kg/hr (1)

【t1/2】 6~8hr (1) 5~7hr (12) 6~7hr (Clin Rheumatol 8: S25-S35,1989) 7.3 \pm 4hr (U) 6.0~7.4hr (11) 【腎不全患者のt1/2】 腎機能正常者と同じ (12)

【蛋白結合率】 98.6~98.9% (1) 99% (U,12) 【透析患者の蛋白結合率】 わずかに低下するがフリー濃度は変化しない (Clin Rheumatol 8: S25-S35,1989)

【Vd】 9.67L/man [po] (1) 0.41L/kg (11) 0.4L/kg (12)

【MW】 287.36

【透析性】 蛋白結合率が高いため透析で除去されにくいと思われる (Clin Rheumatol 8: S25-S35,1989) 資料なし (1)

【TDMのポイント】 TDMの対象にならない 【O/W係数】 17.8 [1-オクタノール/第2液] (1) 【pKa】 4.5 (1)

【効果発現時間】 約30min (1)

【効果持続時間】 6~8hr (1)

【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。