▼ラジカット注 ［注］，▼ラジカット内用懸濁液 ［内］

【重要度】★★　【一般製剤名】エダラボン　Edaravone　【分類】脳保護剤（フリーラジカルスカベンジャー）
【単位】▼30mg/A［20mL］，▼30mg/100mL バッグ，▼21mg/mL（2.1% 懸濁液）
【常用量】■脳梗塞急性期：1 回 30mg1 日 2 回［発症後 24 時間以内に投与を開始し，投与期間は 14 日以内］
■筋萎縮性側索硬化症：1 回 60m g 1 日 1 回［投与期と休薬期を組み合わせた 28 日間を 1 クールとし，これを繰り返す．第 1 クールは 14 日間連日投与する投与期の後 14 日間休薬し，第 2 クール以降は 14 日間のうち 10 日間投与する投与期の後 14 日間休薬する］

■内用懸濁液：筋萎縮性側索硬化症（ALS）における機能障害の進行抑制： 1 回 5mL（エダラボンとして 105mg）を空腹時に 1 日 1 回
▼投与期と休薬期を組み合わせた 28 日間を 1 クールとしこれを繰り返す．第 1 クールは 14 日間連日投与する投与期の後 14 日間休薬，第 2 クール以降は 14 日間のうち 10 日間投与する投与期の後 14 日間休薬する
【用法】■脳梗塞急性期：30 分かけて 1 日 2 回点滴静注．ブドウ糖溶液では希釈不可（1）
■ALS：60 分かけて 1 日 1 回点滴静注
■内用液は 1 日 1 回空腹時（起床時等の 8 時間絶食後など）に経口投与．服用後少なくとも 1 時間は水以外の飲食は避ける
8 時間絶食ができない場合，低脂肪食では摂取後 4 時間以上，軽食では摂取後 2 時間以上あけて服用可．高脂肪食では摂取後 8 時間以上あけて本剤を服用
【透析患者への投与方法】腎機能障害の増悪が表れることがあるため禁忌（1）であるが，無尿患者には通常量の投与が可能かもしれない（5）
【その他の報告】腎機能障害の増悪が現れることがあるため重篤な腎機能障害のある患者には禁忌（1）
【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr 10mL/min 以上：減量の必要なし，Ccr＜10mL/min：腎機能障害の増悪が現れることがあるため重篤な腎機能障害のある患者には禁忌（1）
【その他の報告】腎機能にかかわらず AKI の発現に注意（5）
ALS では筋肉量低下の影響を受けにくい腎機能評価法を用いる（1）
【特徴】脳保護剤で脳梗塞急性期に伴う神経症状，日常生活動作障害，機能障害を改善する．エダラボンは生理条件下でアニオンとなり，その電子を供給することによってハイドロキシラジカルを消去し，脂質過酸化を抑制する．これにより脳細胞（血管内皮細胞・神経細胞）を酸化的障害及び様々な虚血性脳血管障害から保護する．脳梗塞急性期に作用し．脳浮腫，脳梗塞，神経障害，遅発性神経細胞死などの虚血性脳血管障害の発現及び進展（増悪）を抑制することにより脳保護作用を示す．限定された重症度の ALS における機能障害の進行を抑制する効果が認められている．
【主な副作用･毒性】ショック，アナフィラキシー，脳梗塞の再発，脳出血，急性腎不全，腎機能障害の悪化，肝機能障害，黄疸，血球減少，BUN 上昇，蛋白尿，血尿，血清カリウム低下，血清カルシウム低下など
【安全性に関する情報】AKI の症例（Abe M, et al: Ther Apher Dial 11: 235-40, 2007 PMID: 17498008）感染症合併例では AKI を発現しやすい（座間味 義，他: 日本臨床救急医学会雑誌 19: 461-5, 2016）アスピリン併用にても腎障害の頻度上昇なし（Yang HQ, et al: BMJ Open 2022 PMID: 35440453）
【モニターすべき項目】腎機能，肝機能，CBC，血清 K，血清 Ca
【吸収】食事（特に高脂肪食）により吸収が低下するので空腹時経口投与（1）
【F】57.3%［内用懸濁液］（1）
【Tmax】0.44hr（1）
【代謝】硫酸抱合，グルクロン酸抱合される（1）代謝物に活性はない（1）主に UGT1A9 によりグルクロン酸抱合される（Ma L, et al: Drug Metab Dispos 40: 734-41, 2012 PMID: 22238289）
【排泄】尿中未変化体排泄率 0.68%［iv，24hr まで］0.63%［po，48hr まで］（1）尿中にグルクロン酸抱合体として 70～80%回収（1）OAT1，OAT3 が腎取り込みに関与（Mizuno N, et al: Drug Metab Dispos 35: 1429-34, 2007 PMID: 17502342）BCRP，MRP4 が部分的に腎の管腔側排泄に関与（Mizuno N, et al: Drug Metab Dispos 35: 2045-52, 2007 PMID: 17682070）
【CL】683mL/kg/hr（1）
【T1/2】α相 0.27±0.11hr，β相 1.84±0.17hr（1）
【蛋白結合率】91.9%（1）
【Vd】0.93L/kg（1）
【MW】174.20
【透析性】除去されない（1）
【TDM のポイント】TDM の対象にならない
【薬物動態】20～60mg の範囲で線形動態（Li H, et al: Drugs R D 12: 65-70, 2012 PMID: 22762844）
【O/W 係数】17.2［1-オクタノール/buffer，pH6.0］（1）
【相互作用】腎障害を有する薬剤（1）
【主な臨床報告】非心原性虚血性脳卒中に対しての治療効果はオザグレル Na と非劣勢（Shinohara Y, et al: Cerebrovasc Dis 2009 PMID: 19321945）
【備考】内用懸濁液は開封前は冷所保管，開封後は密栓，室温保管し 15 日以内に使用（1）
【更新日】20230422

※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。