

VII 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

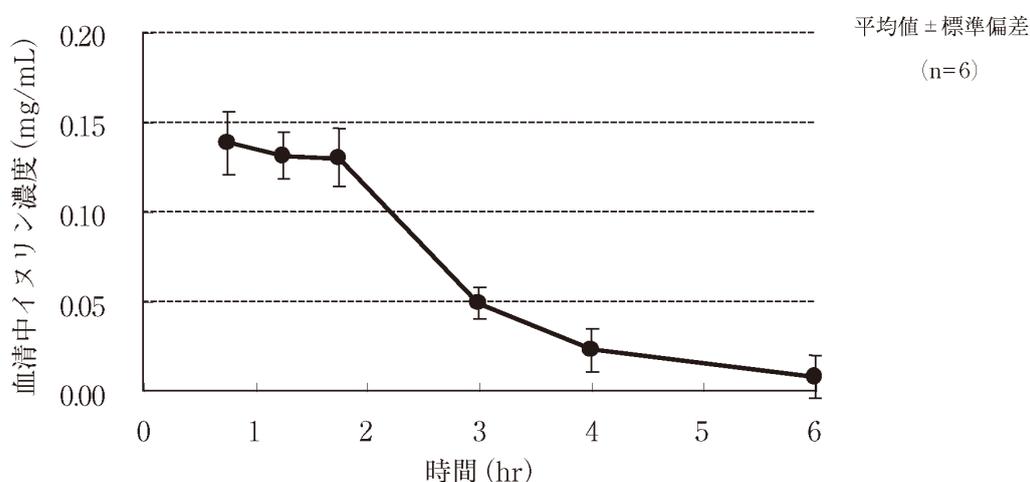
該当しない

(2) 最高血中濃度到達時間

該当しない

(3) 通常用量での血中濃度

健康成人男子(6例)に本剤(イヌリンとして3g)を、最初の30分は300mL/hrの速度で、30～120分までは100mL/hrの速度で維持量を持続静脈内投与したとき、血清中イヌリン濃度は維持量注入時の45～105分の間、ほぼ一定の濃度で推移し(下図)、投与終了後速やかに消失し、投与終了後10時間でほぼ完全に尿中へ排泄されることが示された。



投与量 (g)	Cmax (mg/mL)	t _{1/2} (hr)	AUC _{0-∞} (mg·hr/mL)	MRT (hr)	Cl _{tot} (L/hr)
3	0.139 ± 0.017	1.57 ± 0.74	0.419 ± 0.089	2.53 ± 0.63	7.40 ± 1.41

平均値 ± 標準偏差 (n=5～6)

酵素法により測定

[株式会社富士薬品 社内資料]

2. 薬物速度論的パラメータ

(4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

(1) 吸収速度定数

該当しない

(2) バイオアベイラビリティ

該当しない

	<p>(3) 消失速度定数 該当資料なし</p> <p>(4) クリアランス 1.(3) 参照</p> <p>(5) 分布容積 該当資料なし</p> <p>(6) 血漿蛋白結合率 該当しない</p>
<p>3. 吸収</p>	<p>該当しない</p>
	<p>(1) 血液－脳関門通過性 該当資料なし</p> <p>(2) 胎児への移行性 該当資料なし <参考> 帝王切開前あるいは人工妊娠中絶前の被験者に、イヌリンを静脈内投与したときの臍帯血並びに新生児の血液中濃度あるいは体腔液中濃度を測定した実施例があり、イヌリンは妊娠初期及び後期の胎児へ移行することが報告されている^{6~8)}。</p> <p>(3) 乳汁中への移行性 該当資料なし</p> <p>(4) 髄液への移行性 該当資料なし</p> <p>(5) その他の組織への移行性 該当資料なし</p>
<p>5. 代謝</p>	<p>(1) 代謝部位及び代謝経路^{3,9)} 静脈内投与時のイヌリンは、代謝されない。 <参考> 海外において健康成人4名及び腎機能が低下した患者6名にイヌリンを静脈投与したところ、投与したイヌリンと尿中に排泄されたイヌリンとの分子量分布に相違がないことが報告されている¹⁰⁾。</p>

6. 排泄

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

該当しない

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当しない

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当しない

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当しない

(1) 排泄部位

腎

(2) 排泄率

「1.(3)の試験」において投与終了後10時間までにはほぼ完全に尿中に排泄されることが示唆された。

投与量	イヌリン排泄率 (投与量に対する%)				
	0-2時間	0-4時間	0-8時間	0-12時間	0-24時間
3g	73.6 ± 4.1	101.7 ± 3.6	115.1 ± 4.0	118.2 ± 4.3	119.4 ± 4.1

平均値±標準偏差 (n=6)

酵素法により測定

[株式会社富士薬品 社内資料]

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(3) 直接血液灌流

該当資料なし