

**2013年1月改訂(第6版)

*2012年12月改訂

貯法: 気密容器

使用期限: 外箱等に表示(3年)

高カリウム血症改善剤

日本標準商品分類番号

87219

承認番号 22200AMX00494000

薬価収載 2010年11月

販売開始 2011年2月

ケイキサレート®ドライシロップ76% KAYEXALATE® DRY SYRUP 76%

ポリスチレンスルホン酸ナトリウム (Sodium Polystyrene Sulfonate) 製剤

注意: 本剤2包(3.27g/包×2)は
ケイキサレート散1包(5g)に相当する。
【取扱い上の注意】参照

【組成・性状】

販売名	ケイキサレートドライシロップ76%
成分・含量	1g中 (日局)ポリスチレンスルホン酸ナトリウム 764.5mgを含有
添加物	エリスリトール、ヒドロキシプロピルセルロース、 アルギン酸プロピレングリコールエステル、キシ リトール、無水クエン酸、香料
性状	淡黄褐色～黄褐色の顆粒で芳香がある。 分包品の1包内容量は3.27gである。
識別コード	TO-093DS

【効能又は効果】

急性および慢性腎不全による高カリウム血症

【用法及び用量】

通常、成人1日量39.24g(ポリスチレンスルホン酸ナトリウムとして1日量30g)を2～3回に分け、その1回量を水50～150mLに懸濁し、経口投与する。症状に応じて適宜増減。

3. 副作用

(参考) 1,236例中108例(8.7%)に副作用が認められ、その主な症状は下痢39件(3.2%)、悪心35件(2.8%)、浮腫25件(2.0%)、便秘23件(1.9%)、低カルシウム血症21件(1.7%)、嘔吐20件(1.6%)などであった。(ケイキサレート散承認時及び1975年2月までの副作用調査)

(1) 重大な副作用

1) 心不全誘発(頻度不明)

心不全を誘発することがあるので、ナトリウム摂取を制限するなど十分に注意すること。

2) 腸穿孔、腸潰瘍、腸壊死(頻度不明)

ポリスチレンスルホン酸ナトリウムのソルビトール懸濁液の経口投与により、小腸の穿孔・粘膜壊死⁴⁾、大腸潰瘍、結腸壊死^{4),5)}等があらわれたとの報告がある。

本剤の経口投与により、激しい腹痛又は下痢、嘔吐等があらわれた場合には本剤の投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。

	頻度不明
循環器	浮腫 ^{注1)} 、血圧上昇 ^{注1)}
電解質	低カルシウム血症 ^{注2)} 、低カリウム血症
消化器	下痢、悪心、嘔吐、便秘、胃部不快感、食欲不振、腹痛
その他	眩暈、倦怠感

注1) ナトリウム摂取を制限するなど十分に注意すること。

注2) カルシウム剤の補給などの適切な処置を行うこと。

4. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。

6. 適用上の注意

投与時の注意

本剤の投与では、消化管への蓄積を避けるため、便秘を起こさせないように注意すること。また、便秘を起こした場合は、浣腸等の適切な方法を用いて排便させること。

【薬物動態】

(参考) 動物における体内動態

吸収、排泄

1) 腸管からの吸収

ラットの小腸を用いた反転腸管による吸収実験において、ポリスチレンスルホン酸ナトリウム及びそのアルカリ分解物の吸収は認められなかった。

2) 糞便中への排泄

ラットにポリスチレンスルホン酸ナトリウムを1.1g/匹経口投与し、糞便中の排泄量を測定した結果、24時間後に75.4%、48時間後に95.1%の排泄を認めた。

**【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

過量投与を防ぐため、血清カリウム値及び血清ナトリウム値を測定しながら投与すること。

** 2. 相互作用

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ジギタリス製剤 ジゴキシン ジゴキシン ラナトシドC 等	ジギタリス中毒の症状(食欲不振、悪心・嘔吐、下痢、不整脈、頻脈、高度の徐脈、視覚異常、眩暈、頭痛、失見当識、錯乱など)の増強があらわれることがある。併用する際には血清カリウム値の観察を十分に行い、慎重に投与する。また、血清カリウム値低下に伴う上記症状の出現時には、減量又は投与を中止する。	本剤により血清カリウム値が低下するとジギタリス製剤が心筋Na ⁺ -K ⁺ ATPaseに結合しやすくなり、ジギタリス製剤の効果が強く発現する。
アルミニウム、マグネシウム又はカルシウムを含有する制酸剤又は緩下剤 ^{1)~3)} ケイ酸アルミニウム 水酸化アルミニウムゲル・水酸化マグネシウム スクラルファート 沈降炭酸カルシウム 等	本剤の作用が減弱するおそれがある。併用により全身性アルカローシスなどの症状があらわれたとの報告がある。	含有陽イオンと結合し、本剤のカリウム交換能が低下する。腸管内に分泌された重炭酸ナトリウムが再吸収される。
** 甲状腺ホルモン製剤 レボチロキシン 等	左記薬剤の効果が減弱することがあるので、服用時間をずらすなど注意すること。	本剤が消化管内で左記薬剤を吸着することにより、これらの薬剤の吸収を阻害すると考えられる。

【臨床成績】

(参考)ケイキサレート散の疾患別有効率

疾患名	投与経路	経口投与
慢性腎不全による高カリウム血症		92.3 (239/258)
急性腎不全による高カリウム血症		81.5 (22/27)
計		91.6 (261/285)

有効率% (有効症例数/延症例数)

【薬効薬理】

1. カリウム交換容量^{6), 7)} 及び血清カリウム値低下作用^{8), 9)}

(1)ポリスチレンスルホン酸ナトリウムのカリウム交換容量を測定すると、ポリスチレンスルホン酸ナトリウム1g当り2.81~3.45mEqのカリウムと交換する(日局)。また、生体内ではアンモニア、マグネシウム、有機酸、磷脂蛋白などの他の陽イオンとも結合するためポリスチレンスルホン酸ナトリウム1g当り約1mEqのカリウムと交換する。ポリスチレンスルホン酸ナトリウム1g当りのナトリウム含有量は、約100mg(4.4mEq)である(*in vitro*)。

(2)ケイキサレート散を高カリウム血症の急性及び慢性腎不全患者に、経口投与したところ、血清カリウム値低下作用が認められ、高カリウム血症により悪化していた心電図所見も好転した。

また慢性腎不全で人工透析を受けている患者にケイキサレート散を併用すると、透析前の血清カリウム値が低下し、透析前後における血清カリウム値の変動幅を小さくできた。

2. 生物学的同等性試験¹⁰⁾

(1)両腎摘出ラットにおける薬力学的同等性試験

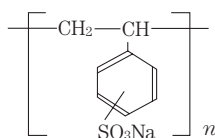
本剤と、その含有量に相当するケイキサレート散を、高カリウム血症モデルである両腎摘出ラットに2日間、計5回経口投与した結果、両剤の血清カリウム値低下作用は同等であった。

(2)カリウム交換容量比較試験

本剤と、その含有量に相当するケイキサレート散のカリウム交換容量を、*in vitro* (KCl溶液) で比較した結果、同等であった。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：不規則に入り乱れた複雑な立体構造を有するが、次のような一般構造式で示される。



一般名：ポリスチレンスルホン酸ナトリウム
(Sodium Polystyrene Sulfonate)

化学名：benzene, ethenyl-, homopolymer sulfonated,
sodium salt

性状：本品は黄褐色の粉末で、におい及び味はない。
本品は水、エタノール(95)、アセトン又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

- (1)本剤は、2包でポリスチレンスルホン酸ナトリウム5g(ケイキサレート散1包)に相当する。また、本剤1.308gがポリスチレンスルホン酸ナトリウム1gに相当する。
- (2)本剤は内服専用剤であるため、注腸投与しないこと。
- (3)誤用に注意し、小児の手のとどかない所に保管すること。

【包装】

3.27g×84包(2包×42)

【主要文献】

- 1) E.T.Schroeder : Gastroenterology, **56**(5), 868, 1969
- 2) P.C.Fernandez et al : N.Engl.J.Med., **286**(1), 23, 1972
- 3) H.A.Ziessman et al : South.Med.J., **69**(4), 497, 1976
- 4) A.Rashid et al : Am.Surg.Pathol., **21**(1), 60, 1997
- 5) B.B.Gerstman et al : Am.J.Kidney Dis., **20**(2), 159, 1992
- 6) 第十六改正 日本薬局方解説書
- 7) R.B.Flinn et al : N.Engl.J.Med., **264**(3), 111, 1961
- 8) 柴垣昌功ほか : medicina, **6**(12), 1388, 1969
- 9) 高須照夫 : 日本臨牀, **28**(7), 1941, 1970
- 10) 畔取政行ほか : ケイキサレートドライシロップ76%とケイキサレート散の同等性試験(鳥居薬品社内資料)

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても、下記にご請求ください。

鳥居薬品株式会社 お客様相談室
〒103-8439 東京都中央区日本橋本町3-4-1
TEL 0120-316-834
FAX 03-3231-6890

* 提携

SANOFI

製造
販売元



鳥居薬品株式会社
東京都中央区日本橋本町3-4-1