

DI 委員会トピックス

ロケルマ懸濁用散分包について

【ロケルマの特徴】

ロケルマ（一般名：ジルコニウムシクロケイ酸ナトリウム水和物）は日本における高カリウム血症治療薬として 45 年ぶりの新有効成分含有製剤である。

本剤はカリウムイオンの直径に近い均一な微細孔構造を有する非ポリマー無機結晶の陽イオン交換化合物であり、消化管内腔でカリウムイオンを選択的に捕捉する。すなわちマグネシウム (Mg^{2+}) やカルシウム (Ca^{2+})、アルミニウム (Al^{3+}) 等の多価陽イオンが存在していたとしても、 K^+ を優先的に取り込むといった特徴があることからマグネシウム、カルシウム、アルミニウムを含有する制酸剤又は緩下剤による作用の減弱が起こりにくいと考えられる。

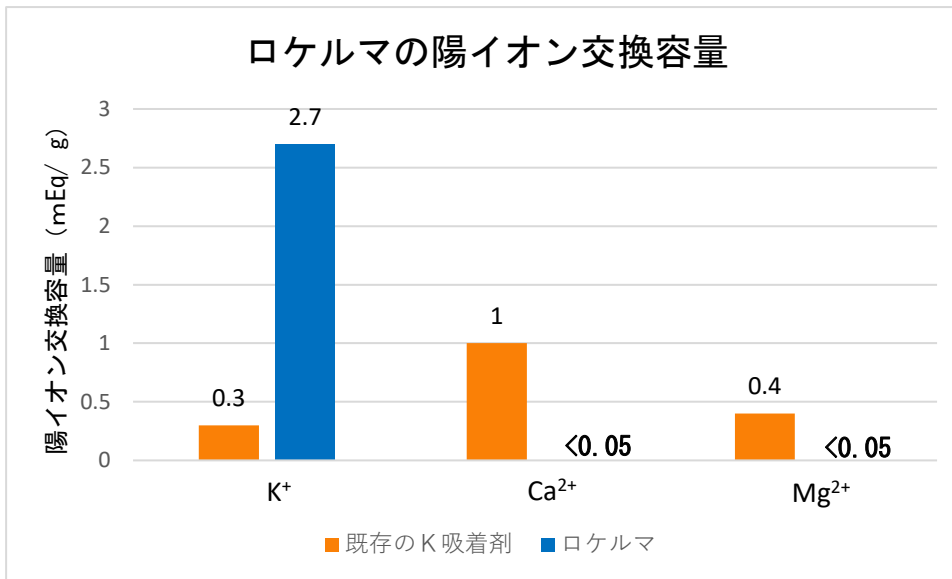
また、本剤は水分により膨潤しない性質を有するため腸管内で膨張することはなく、従来のポリマー陽イオン交換化合物で問題となっていた便秘や腹痛、腹部膨満感のリスクが軽減される。

本剤は消化管から体内に吸収されないと考えられている。

名称の由来

「下げる(lower)」と「カリウム血症(kalemia)」から「LOKELMA」と命名された。

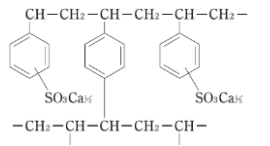
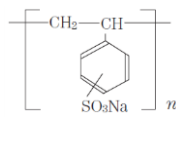
【ロケルマの各種イオンに対する選択性 (in vitro)】



ロケルマはカリウムイオンを選択的に捕捉したが、カルシウムイオン及びマグネシウムイオンに対する捕捉は検出限界以下 (<0.05) であった。

ロケルマの微孔開口径が平均約 3 Å であり、カリウムイオンの直径 2.98 Å に近いことからカリウムイオンを選択的に捕捉できると考えられている。

【ロケルマと従来のカリウム交換樹脂製剤との比較】

重合体	非ポリマー	ポリマー		
製品名	ロケルマ	アーガメイト	カリメート	ケイキサレート
成分名	ジルコニウムシクロケイ酸ナトリウム水和物	ポリスチレンスルホン酸カルシウム		ポリスチレンスルホン酸ナトリウム
構造式	$\text{Na}_x\text{H}_y\text{ZrSi}_3\text{O}_9 \cdot z\text{H}_2\text{O}$ ($x+y=2, 2 \leq z \leq 3$)			
剤形	懸濁用散	ゼリー 顆粒	散 ドライシロップ 経口液(懸濁液)	散 ドライシロップ
適応症	高カリウム血症	急性および慢性腎不全に伴う高カリウム血症		
用法・用量	<p><u>経口投与</u> 通常、成人には、開始用量として 1 回 10g を水で懸濁して 1 日 3 回、2 日間経口投与する。なお、血清カリウム値や患者の状態に応じて、最長 3 日間まで経口投与できる。以後は、1 回 5g を水で懸濁して 1 日 1 回経口投与する。なお、血清カリウム値や患者の状態に応じて適宜増減するが、最高用量は 1 日 1 回 15g までとする。</p> <p>血液透析施行中の場合には、通常、1 回 5g を水で懸濁して非透析日に 1 日 1 回経口投与する。なお、最大透析間隔後の透析前の血清カリウム値や患者の状態に応じて適宜増減するが、最高用量は 1 日 1 回 15g までとする。</p>	<p><u>経口投与</u> 通常、成人 1 日量 1 日 15～30g を 2～3 回に分け、その 1 回量を水 30～50mL に懸濁し、経口投与する。 (ゼリー) 1 日 75～150g (ポリスチレンスルホン酸カルシウムとして 15～30g) を 2～3 回にわけ、経口投与する。 なお、症状により適宜増減する。</p> <p><u>注腸投与(散のみ)</u> 通常成人 1 回 30g を水または 2%メチルセルロース液 100mL に懸濁して注腸する。体温程度に加温した懸濁液を注腸し 30 分から 1 時間腸管内に放置する。液がもれてくるようであれば枕で臀部挙上するか、或いはしばらくの間膝胸位をとらせる。水または 2%メチルセルロース溶液にかえて 5%ブドウ糖溶液を用いてもよい。</p>	<p><u>経口投与</u> 通常、成人 1 日量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する。</p> <p><u>注腸投与(散のみ)</u> 通常、成人 1 回 30g を水または 2%メチルセルロース溶液 100mL に懸濁して注腸する。症状に応じて適宜増減。</p>	
禁忌	該当なし	腸閉塞の患者 (腸管穿孔を起こすおそれあり)		該当なし
併用注意	<ul style="list-style-type: none"> ・抗 HIV 薬 ・アゾール系抗真菌剤 ・チロシンキナーゼ阻害剤 	<ul style="list-style-type: none"> ・ジギタリス製剤 ・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 ・甲状腺ホルモン製剤 		
薬価	5g:1,095.20 円/包 10g:1,601.00 円/包	ゼリー:75.10 円/個 顆粒:12.10 円/g	散:13.40 円/g D.S:14.20 円/g 経口液:77.80 円/包	散:15.80 円/g D.S:14.10 円/g

参考

- ・ロケルマ製品情報概要
- ・ロケルマ患者使用ガイド
- ・ロケルマインタビューフォーム
- ・HARMONIZE-Global 試験:ESC Heart Fail. 2020 Feb;7(1):54-64.
- ・DIALIZE 試験:J Am Soc Nephrol. 2019 Sep;30(9):1723-1733