

▼レルパックス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 エレトリプタン臭化水素酸塩 (U) **eletriptan hydrobromide** 【分類】 5-HT_{1B/1D} 受容体作動型片頭痛治療剤

【単位】 ▼20mg/錠

【常用量】 20mg [最大 40mg/日] (1回 20mg で効果が不十分の場合には、次回から 40mg 投与可能)

【用法】 片頭痛の頭痛発現時に頓服 (2hr 以上あけて追加投与可能)

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (5) 【その他の報告】 重度の腎機能障害患者における t_{max} は延長するが、その他の薬物動態パラメータに影響なし (1)

【特徴】 セロトニン受容体のサブタイプである 5-HT_{1B/1D} 受容体に対して選択的に作動作用を有する片頭痛治療薬。脳動脈に多く存在する 5-HT_{1B/1D} 受容体に作用し脳血管系に対して選択的な収縮作用を示し、頭痛発現後の服用で効果が得られる。服用 2 時間後に頭痛改善効果がみられる。

【主な副作用・毒性】 浮動性めまい、傾眠・眠気、嘔気、口内乾燥、疲労、不整脈、狭心症、心筋梗塞、ショック、アナフィラキシー、頻脈、てんかん様発作など

【吸収率】 81% (1)

【F】 36.4~46.9% (1) 約 50% (U)

【t_{max}】 1~2hr (1) 1.5~2hr (U) 1~1.25hr (Shah AK, et al: J Clin Pharmacol 42: 520-7, 2002)

【代謝】 主に肝臓において代謝され N-酸化体および活性代謝物である N-脱メチル体となる。その他に約 10 種類の未同定酸化代謝物があると推定される (1) 主として CYP3A4 で代謝される (U) CYP3A4 で未変化体と同程度の活性を有する N-脱メチル体に変換されるが、活性代謝物の AUC 比は 14% と小さい (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 18% [iv], N-脱メチル体の尿中排泄率 2% (1) 尿中回収率 55% [iv, 216hr まで] (1)

【CL】 557mL/min (1) 【腎 CL】 64.3~85.0mL/min (1) 腎 CL 3.9L/h (U) 【腎 CL/総 CL】 10% (U) 11.5~15.4% (1)

【t_{1/2}】 3~4hr (1) 約 4hr (U) 3.6~7hr (Shah AK, et al: J Clin Pharmacol 42: 520-7, 2002) 【Ke】 0.129~0.232/hr, 用量依存的に低下する (1)

【蛋白結合率】 87% (1) 85% (U)

【Vd】 119L/man (1) 138L/man (U)

【MW】 463.4

【透析性】 分布容積が大きく蛋白結合率も高いため透析では除去されにくいと考えられる (5) 不明 (U) 資料なし (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない 【O/W 係数】 LogP=1.10 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】 9.82 (1)

【相互作用】 エルゴタミン、他のトリプタン、CYP3A4 阻害剤との併用禁忌 (1)

【効果発現】 約 2 時間 (1)

【更新日】 20180416

※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。