

## △アレロック錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】オロパタジン塩酸塩 (U) Olopatadine Hydrochloride 【分類】アレルギー性疾患治療剤

【単位】▼2.5mg・△5mg/錠

【常用量】10mg/日

【用法】分2 (朝・寝る前)

【透析患者への投与方法】1回2.5mgを1日1回 (5)

【その他の報告】PD患者の好酸球性胸膜炎に対して5mg/日で有効であった (前原優一, 他: 透析会誌 46: 943-7, 2013)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr>50mL/min: 減量の必要なし, Ccr 10~50mL/min: 1回2.5~5mgを1日1~2回, Ccr<10mL/min: 1回2.5mgを1日1回 (5)

【その他の報告】高い血中濃度が持続するおそれがあるため腎機能低下患者には慎重投与 (1) 健康成人と比較してCcr 2.3~34.4mL/minの腎機能低下患者のCmaxは2.3倍, AUCは約8倍になる (1)

【特徴】1日2回型の選択的ヒスタミンH1受容体拮抗作用。選択的な抗ヒスタミン作用, 各種ケミカルメディエーター, 血小板活性化因子(PAF), IL-6及びIL-8の産生・遊離抑制作用, 好酸球の活性・遊走抑制作用, 血管内皮細胞における細胞接着分子の発現抑制作用等が認められている。

【主な副作用・毒性】眠気, 口渇, 倦怠感, 過敏症, 肝障害, 劇症肝炎, 消化器症状など

【吸収】ka=2.95/hr (1)

【F】尿中回収率から75%以上 (1) 60% [ラット] (1)

【tmax】0.92~1hr (1) 1.02±0.34hr (Chu NN, et al: Clin Drug Investig 29: 451-7, 2009)

【代謝】尿中回収物からN-酸化体, N-モノ脱メチル体が検出されているが存在率は低い (U)

【排泄】尿中未変化体排泄率63.0~71.8% [po, 48hr まで] (1) 58%以上 (Ohmori K, et al: Jpn J Pharmacol. 88: 379-97, 2002) 58~73% (大森健守, 他: 日薬理誌 118: 51-8, 2001) 腎CLはCcrよりも高いために糸球体ろ過だけでなく尿細管分泌されていると考えられる (Takeishi T, et al: Drug Exp Clin Res 24: 1-7, 1998) P-gpの基質である可能性 (1)

【CL/F】19.33L/hr (1) 腎CLはCcrと相関する (大森健守, 他: 日薬理誌 118: 51-8, 2001) 23.45±12.59L/hr (Chu NN, et al: Clin Drug Investig 29: 451-7, 2009)

【t1/2】7.13~8.75hr (1) 3hr (U) 7~9hr (大森健守, 他: 日薬理誌 118: 51-8, 2001) 5.87±4.24hr (Chu NN, et al: Clin Drug Investig 29: 451-7, 2009) 【Ke】0.0716/hr (1)

【蛋白結合率】約32% [ヒト] (1) 55% [vitro] (1)

【Vd/F】305±109L/man (1) P-gpの基質であるため脳内移行が制限されている (Mimura N, et al: Drug Metab Pharmacokinet 23: 106-14, 2008) 133.83 ± 43.07L/man (Chu NN, et al: Clin Drug Investig 29: 451-7, 2009)

【MW】373.87

【透析性】分布容積が比較的大きいため, 効率的には除去できないと思われる (5)

【O/W係数】LogP=0.3 [1-オクタノール/水系, pH7.4] (1)

【相互作用】設定されていない (1)

【更新日】20230518

※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。