

◎スピリーバレスピマット 60 吸入 [外]

【重要度】 【一般製剤名】チオトロピウム臭化物水和物 (U) Tiotropium Bromide Hydrate 【分類】吸入気管支拡張剤 [LAMA]

【単位】◎1 吸入 2.5 μ g/レスピマット [1 本 60 吸入], ▼1 吸入 1.25 μ g/レスピマット [1 本 60 吸入]

【常用量】■COPD : 5 μ g/日 ■BA : 2.5 μ g/日 [最大 5 μ g/日] 吸入ステロイド等と併用

※スピリーバカプセルは COPD 適応のみ

【用法】1 回 2 吸入 1 日 1 回

【透析患者への投与方法】慎重投与 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Cr 50mL/min 以下の患者には慎重投与 (1)

【その他の報告】GFR 50mL/min 未満の心房細動を合併した患者において、事故で 5 カプセルを吸入してしまい、頻脈が発現した報告がある (Gregory MD, et al: Ann Pharmacother 44: 391-3, 2010)

【特徴】ムスカリン受容体 (M3) からの解離半減期が長い長時間作用型吸入気管支拡張剤。COPD, BA に適用される。

【主な副作用・毒性】口渇, 咽頭刺激感, 咳, 心不全, 心房細動, 期外収縮, 頻脈, 尿閉など。

【安全性に関する情報】COPD 患者の死亡率上昇に関連するとのメタ解析あり (Singh S, et al: BMJ 342, 2011) 閉塞隅角緑内障・前立腺肥大に伴う排尿障害に禁忌 [実際には全身性の抗コリン作用は大量投与でない限り発現しないので適用できる] (1)

【BA】19.5% (吸入対静注) (1) 肺・気道から吸収 (1) 消化管からの吸収率は 2.6% (1)

【tmax】吸入後 5min (U) Cmax はカプセル剤より高い (1)

【代謝】ほとんど代謝されない (U) 血漿中で非酵素的にエステル結合が加水分解され、N-メチルスコピンおよびジチニールグリコール酸を生成 (1) 肝 CYP2D6, 3A4 がわずかに関与 (1) 代謝物に活性はない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 74% [iv] (1) 吸入時 14% (U)

【CL】880mL/min [iv] (1)

【t1/2】5~6 日 (1,U)

【蛋白結合率】71.4~73.0% (1) 72% (U)

【Vd】32L/kg [iv] (1) 33L/kg (U) BBB を通過しない [ラット] (U)

【MW】490.43

【透析性】低いと思われる (5)

【薬物動態】静注時の Cmax, AUC は腎機能低下に伴い 1.5~2.0 倍に上昇 (1)

【O/W 係数】LogP=-2.28 [1-オクタノール/水系] (1)

【備考】全身性の抗コリン作用は大量投与でない限り発現しない。

【更新日】20241121

※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。