

## △エボザックカプセル, ▼サリグレンカプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】セビメリン塩酸塩水和物 (U) Cevimeline Hydrochloride Hydrate 【分類】口腔乾燥症状改善薬

【単位】△30mg/Cap

【常用量】90mg/日

【用法】分3

【透析患者への投与方法】慎重投与 (1)

【その他の報告】尿中排泄率が低いため減量の必要はないと思われる (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】慎重投与 (1)

【その他の報告】尿中排泄率が低いため減量の必要はないと思われる (5)

【特徴】唾液腺の M3 受容体を刺激し、唾液分泌を亢進することによりシェーグレン症候群患者の口腔乾燥症状を改善する。

【主な副作用・毒性】消化器症状、多汗、めまい、味覚異常、肝障害など

【F】不明 (1) ラット：52.9%、イヌ 27.9% (1) ヒトではほぼ完全に吸収される (Washio T, et al: Arzneimittelforschung 53: 80-6, 2003)

【Tmax】1.0~2.2hr (1) 空腹時 1.53hr, 食後 2.86hr (U)

【代謝】CYP2D6 および 3A4 により、トランススルホキシド体およびシススルホキシド体に代謝 (1) スルホキシド化、N-酸化は CYP および FMO により触媒 [ラット、イヌ] され、ラットミクロソームでは CYP2D6 と 3A がスルホキシド化に関与 (Washio T, et al: Arzneimittelforschung 53: 26-33, 2003) 代謝物に活性はない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 18.2±8.6% [24hr まで] (1) その他は活性を有しない代謝物として尿中排泄 (1) 168hr までの尿中回収率 97.3%で、24hr までの尿中回収率は未変化体 16.0%、トランススルホキシド体 35.8%、シススルホキシド体 8.7%、N-オキシド体 4.1%、グルクロン酸抱合体 14.6%、トランススルホキシド体のグルクロン酸抱合体 7.7% (Washio T, et al: Arzneimittelforschung 53: 80-6, 2003)

【CL】1.0L/hr/kg (1) 【非腎 CL/総 CL】85% (1)

【t1/2】2.7~4.3hr (1)

【蛋白結合率】17.4~19.5% (1) 20%未満 (U)

【Vd】Vd/F=5.2L/kg (1) 6L/kg (U)

【MW】244.79

【透析性】不明 (1) Vd が比較的大きいため効率的には除去されないと思われる (5)

【TDM のポイント】TDM の対象にならない 【O/W 係数】2.3 [1-オクタノール/buffer, pH8.0] (1) 【pKa】8.94

【相互作用】CYP2D6, 3A4 阻害剤との併用に注意 (1)

【主な臨床報告】多汗は長期持続しやすいが、嘔気・嘔吐は投与初期に多く、その後徐々に軽減する (岩淵 博史: 歯科薬物療法 36: 25-28, 2017)

【備考】

【更新日】20220423

※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。