

◎セレコックス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 セレコキシブ (U) celecoxib 【分類】 非ステロイド性消炎・鎮痛剤 [COX-2 選択的阻害剤]

【単位】 Δ 100mg・ \odot 200mg/錠

【常用量】 ■関節リウマチ：1回100～200mgを1日2回，朝・夕食後

■変形性関節症等：1回100mgを1日2回，朝・夕食後

■術後，抜歯後：初回400mg，2回目以降は1回200mg，1日2回

【用法】 1日2回朝・夕食後

【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】 軽度腎障害患者はみかけの経口 CL の 47% 上昇により，健康人と比べ AUC が 43% 低下する (Davies NM, et al: Clin Pharmacokinet 38: 225-42, 2000)

GFR 30mL/min 未満：データが少なく，腎毒性，消化器毒性のためできれば避ける。必要なら低用量から開始して注意してモニター (17)

【特徴】 コキシブ系 COX-2 選択性の NSAID。消化管及び血小板に対する影響は既存の NSAID よりも少ない [ラット]。

【主な副作用・毒性】 腹痛，口内炎，発疹，下痢，嘔気，ショック，アナフィラキシー，間質性肺炎，消化性潰瘍，心筋梗塞，脳卒中，心不全，肝機能障害，再生不良性貧血など

【安全性に関する情報】 高齢女性で AUC が増大 (1) 120 日以上長期投与では従来の NSAIDs よりも消化管出血が有意に少ないが，心血管および腎障害のリスクはむしろ高かった (Shin S: J Pain Re11: 3211-3219, 2018 PMID: 30588073)

【吸収】 K_a 1.62 \pm 0.275/hr, 速やかに吸収される (U) 食事による AUC への影響は小さい (Paulson SK, et al: J Pharmacol Exp Ther 297: 638-5, 2001)

【F】 ヒトでのデータなし (1)

【 t_{max}] 2.0～2.2hr, 腎障害患者 5.40 \pm 4.65hr (1) 3hr (U) 4～5hr (Davies NM, et al: Clin Pharmacokinet 38: 225-42, 2000) 溶液の場合 1hr, カプセルの場合 2～3hr で，崩壊が律速段階となっている可能性がある (Paulson SK, et al: J Pharmacol Exp Ther 297: 638-45, 2001)

【代謝】 主として CYP2C9 が関与，3A4 も関与する可能性あり (1) CYP2C9 により不活性化代謝物に変換 (U) 酸化的代謝によってメチル基が水酸化され，さらにカルボン酸体に変換される [ラット] (Paulson SK, et al: Drug Metab Dispos 28: 514-21, 2000) CYP2C9 の PM では AUC が増大する [特に CYP2C9*3 の影響が大きい] (Tang C, et al: Pharmacogenetics 11: 223-35, 2001) 加齢や CYP2C9 の遺伝的多型の AUC への影響は小さく，CYP2C9 以外にも代謝に関与する酵素が存在する可能性がある (Brenner SS, et al: Clin Pharmacokinet 42: 283-92, 2003)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 3% 未満 (1, U) 2% (Davies NM, et al: Clin Pharmacokinet 38: 225-42, 2000) 尿中排泄率 27% で，大部分は代謝物として糞便中あるいは尿中に排泄される (1, U) 尿中排泄物の大部分はカルボン酸代謝物 (Paulson SK, et al: Drug Metab Dispos 28: 308-14, 2000)

【CL】 21.2 \pm 0.551L/hr [po] (1)

【 $t_{1/2}$] 5.3～9.2hr, 腎障害患者 13.10 \pm 6.79hr (1) 11hr (U)

【蛋白結合率】 約 97% (1, U) 97.4% (Paulson SK, et al: Biopharm Drug Dispos 20: 293-299, 1999)

【Vd】 $V_d/F=335\pm 33.5L/man$ (1) 455 \pm 166L/man (Davies NM, et al: Clin Pharmacokinet 38: 225-242, 2000)

【MW】 381.37

【透析性】 透析されないとされる (U) 資料なし (1)

【OW 係数】 10000 以上 [1-オクタノール水系, pH7.0] (1) [pKa] 11.1

【相互作用】 vitro では CYP1A2 を阻害するが，vivo では阻害しない (Karjalainen MJ, et al: Eur J Clin Pharmacol 54: 511-9, 2008) リファンピシム 600mg \times 11 日間併用により血中濃度が 50% 低下 (Porrás AG, et al: Clin Pharmacol Ther 69: 275-82, 2000) フルコナゾールの CYP2C9 阻害の影響を受けるため，セレコキシブを低用量から開始 (1) 酸化 Mg との併用により血中濃度低下 (1) クロピドグレル併用による脳出血発現の症例報告 (Fisher AA, et al: Ann Pharmacother 35: 1567-9, 2001) アスピリンの抗血小板作用には影響しない (Gladding PA, et al: Am J Cardiol 101: 1060-3, 2008) P-gp の基質でもなく，阻害剤でもない (de Vries EF, et al: Nucl Med Biol 35: 459-66, 2008) MRP4/MRP5 の発現を誘導するので，その基質との併用には注意 [vitro] (Gradilone A, et al: Curr Cancer Drug Targets 8: 414-20, 2008) CYP2D6 を阻害してメトプロロールの AUC を増大させる (Werner U, et al: Clin Pharmacol Ther 74: 130-7, 2003)

【小児における報告】 6.9～16.2 歳の小児に 250mg/m² を 12hr 毎投与した際の PK 解析 (Stempak D, et al: Clin Pharmacol Ther 72: 490-7, 2002) CYP2C9 の PM では血中濃度が上昇するため副作用に注意 (Stempak D, et al: Clin Pharmacol Ther 78: 309-10, 2005 [letter])

【備考】 セレコキシブ単独は，ジクロフェナク+オベプラゾール併用よりも消化管出血や消化管由来の貧血のリスクが低い (Chan FKL, et al: Lancet 9736: 173-9, 2010)

【更新日】 20190109

※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。