

▼アコレート錠 [内] <製造中止>

【重要度】<製造中止> 【一般製剤名】ザフィルルカスト (U) zafirlukast 【分類】ロイコトリエン受容体拮抗薬

【単位】▼20mg・▼40mg/錠

【常用量】40～80mg/日 [高齢者 40mg/日まで]

【用法】分2 [朝・寝る前]

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (1,3)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (1,3,12)

【特徴】ロイコトリエン受容体拮抗剤で β_2 刺激薬の使用量減少が期待できる。抗炎症作用、気管支収縮抑制作用をあわせもつ

【主な副作用・毒性】重篤な肝障害、血液障害、好酸球性肺炎、めまい、頭痛、消化器症状など

【モニターすべき項目】肝機能

【吸収】急速に吸収されるが、高脂肪食・高蛋白食でFは低下する (U) 食事によるBAが40%低下 (Dekhuijzen PN: Clin Pharmacokinet 41: 105-14, 2002)

【F】55% (1) 不明 (Dekhuijzen PN: Clin Pharmacokinet 41: 105-14, 2002)

【tmax】2.8～3.0hr (1) 3hr (U)

【代謝】肝代謝。CYP2C9が関与 (1) 代謝物の活性は低い (1) CYP2C9により90倍活性の低い代謝物に変換 (U)

【排泄】尿中に未変化体は検出されない (1) 代謝物を含め90%が糞便中排泄 (1) 尿中回収率10% (U, Dekhuijzen PN: Clin Pharmacokinet 41: 105-14, 2002) 糞便中90% (U) 尿中未変化体排泄率5%未満 (12)

【CL】21～32L/hr (1)

【t1/2】2.5～8.5hr (1) 10hr (U,12) 腎不全患者でも延長しない (1,12)

【蛋白結合率】アルブミンと99%以上結合 (1,U,12)

【Vd】資料なし (1,12)

【MW】575.68

【透析性】資料なし (1) PBRが高く、Vdが大きいため除去されないと思われる (5)

【O/W 係数】LogP=2.3 (1) 【薬物動態】2-コンパートメントモデルに適合 (Dekhuijzen PN: Clin Pharmacokinet 41: 105-114, 2002)

【相互作用】ワルファリンの作用増強 [CYP2C9を介するもの] (1) フルコナゾール併用によりCmax, AUCが上昇 [tmax, t1/2は変化なし] するが、イトラコナゾール併用の影響はない (Karonen T, et al: Eur J Clin Pharmacol 68:681-688, 2012) アジズロマイシン、クラリスロマイシンとの相互作用を認めない (Garey KW, et al: Antimicrob Agents Chemother 43: 1152-5, 1999)

【主な臨床報告】高齢の喘息患者での効果は限定的である (Creticos P, et al: Ann Allergy Asthma Immunol 88: 401-9, 2002)

【更新日】20170119

※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。