

▼ゾーミッグ錠・▼RM錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ゾルミトリプタン (U) zolmitriptan 【分類】5-HT_{1B/1D} 受容体作動型片頭痛治療薬

【単位】▼2.5mg/錠

【常用量】2.5mg/回 [最大10mg/日まで] ■2.5mg で効果不十分な場合、次回発作時には1回5mg が選択可能

【用法】頭痛発現時に経口投与 [投与間隔2時間以上あける]

【透析患者への投与方法】慎重投与 (U)

【その他の報告】減量の必要なし (5)

【保存期CKD患者への投与方法】慎重投与 (U)

【その他の報告】減量の必要なし (5) 腎障害患者では半減期が1hr延長する程度であり減量を要するものではない (1) 高齢者でのPK変化は認められない (1) 腎障害患者では活性を有するN-脱メチル化体のAUCが健康人に比べ35%高値で、t_{1/2}が1hr延長するものの臨床で大きな変化ではない (1)

【特徴】5-HT₃ 受容体の1B, 1D サブタイプに親和性を有するセロトニン作動薬。N-脱メチル化体の活性は未変化体の2~7.9倍であり、血中濃度は未変化体の1/2である。

【主な副作用・毒性】悪心、知覚減退、傾眠、片頭痛の悪化、めまい、異常感覚、ショック、アナフィラキシー、不整脈、狭心症、心筋梗塞を含む虚血性心疾患様症状、頻脈、てんかん様発作など

【吸収】食事の影響を受けない (1)

【F】40% (1,U)

【t_{max}】未変化体、活性代謝物 (N-脱メチル体) とともに約3hr (1)

【代謝】主にCYP1A2で活性代謝物のN-脱メチル体に変換され、N-脱メチル体の代謝には主にA型モノアミン酸化酵素 [MAO-A] が関与 (1) インドール酢酸、N-オキシド体、N-脱メチル体の3種が同定されており、N-脱メチル体のみ活性を有する (U) N-脱メチル体は未変化体の2~7.9倍の受容体親和性を有する (1)

【排泄】主として尿中に排泄され一部糞便中に排泄 (1) 60%以上が尿中 [主代謝物または代謝物であるインドール酢酸体] に、約30%が糞便中 [ほとんど未変化体] に排泄 (1) 尿中回収率65%で未変化体として8%、インドール酢酸31%、N-オキシド体7%、N-脱メチル化体4% (U) 糞便中排泄率30% (U)

【CL】約10 mL/min/kg [iv] (1)

【t_{1/2}】2.4hr (1) 未変化体3hr、N-脱メチル体3hr (U) 2.5hr (Yates RA, et al: Eur J Clin Pharmacol 58: 247-52, 2002)

【蛋白結合率】25% (U) 20% (1)

【Vd】2.4L/kg (1)

【MW】287.36

【透析性】Vdが比較的大きく、効率的には除去されないと思われる (5) データなし (1)

【O/W係数】0.07 [1-オクタノール/buffer, pH7] (1) 【pKa】9.51

【相互作用】エルゴタミン、MAO-A阻害剤との併用禁忌 (1) CYP1A2阻害剤、SSRIとの併用注意 (1)

【備考】片頭痛の頭痛発現時に限り使用し、予防的に使用しない

【更新日】20180416

※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。