▼ジェイゾロフト錠・△セルトラリンOD錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】セルトラリン塩酸塩（U）　Sertraline Hydrochloride　【分類】抗うつ薬［SSRI］
【単位】△25mg・△50mg・▼100mg/OD錠
【常用量】初期量25mg/日，漸増し最大100mg/日
【用法】1日1回
【透析患者への投与方法】減量の必要なし（1,3）（Cohen LM, et al: Psychosomatics 2004 PMID: 14709759）
【その他の報告】クリアランスが低下しているため少量から開始（Schwenk MH, et al: Clin Nephrol 44: 121-4, 1995）
作用メカニズムは不明であるが，透析時の血圧低下を改善させる可能性がある（Yalcin AU, et al: Blood Purif 20: 150-3, 2002）
透析時の血圧には影響しない（Brewster UC, et al: Nephrology (Carlton) 8: 296-301, 2003）
透析時の低血圧の頻度や症状を改善する可能性（Molin CZZD, et al: J Bras Nefrol 2019 PMID: 31419272）
HD患者には比較的安全だと思われるがデータが少なすぎる［Review］（Kubanek A, et al: Medicina (Kaunas) 2021 PMID: 34577872）
【PD】減量の必要なし（12）
【CRRT】減量の必要なし（12）
【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし（1,3,12）
【その他の報告】CKD G3-5に対してのうつ病治療への効果は認められず，消化器症状が多い（Hedayati SS, et al: JAMA 2017 PMID: 29101402）
【特徴】うつ病に対しての再燃抑制効果が示された抗うつ薬．CYPに対する影響が少ない．
【主な副作用・毒性】悪心，傾眠，口内乾燥，頭痛，下痢，浮動性めまい，セロトニン症候群，悪性症候群，痙攣，昏睡，肝機能障害，SIADH，SJS，TEN，QT延長，不安，焦燥，眼圧上昇など．
【安全性に関する情報】他のSSRIに比べ下痢の頻度が高い（Meijer WE, et al: Pharmacoepidemiol Drug Saf 11: 655-62, 2002）離脱症候群の症例は1～5日で発現し，ほぼ自然軽快するが，症状として倦怠感，めまい，発熱などがある（Fava GA, et al: Psychother Psychosom 84: 72-81, 2015）
【吸収】高率に腸肝循環する．吸収率は94.3%以上（ラット）（1）初回通過効果を受ける（11）空腹時投与で吸収が30%程度低下（11）
【F】36%［ラット］（1）不明であるがおそらく低い5%程度（11）
【tmax】6.3～8.7hr，Ccr 20～50mL/min：5.8±2.8hr，Ccr＜20mL/min：4.5±2.3hr（1）ゆっくり吸収され6～8hr（11）
【代謝】N-脱メチル化体が主代謝物でその他グルクロン酸抱合，カルバモイル-O-グルクロン酸抱合体になる（11）主代謝物はデスメチルセルトラリン（活性は弱い）．CYP2C19，CYP2C9，CYP2B6及びCYP3A4等で代謝（1）活性代謝物なし（Cohen LM, et al: Psychosomatics 2004 PMID: 14709759）N-脱メチル化体の活性［セロトニン再取り込み阻害作用として］は未変化体のおよそ10%（11, Koe BK, et al: J Pharmacol Exp Ther 226: 686-700, 1983）N-脱メチル化にはCYP2C19が関与（Wang JH, et al: Clin Pharmacol Ther 70: 42-47, 2001）
【排泄】尿中未変化体排泄率約0.1%［ラット，24hrまで］（1）胆汁中への排泄率78.2%［ラット，48hrまで］（1）尿中未変化体排泄率0.2%未満（U,11）尿中回収率40～45%（投与後9日）（U）糞便中未変化体排泄率12～14%，糞便中回収率40～45%（U）
【CL】5mg/kg静注時：59mL/min/kg（ラット）（1）
【t1/2】22.5～24.1hr，Ccr 20～50mL/min：27.9hr，Ccr＜20mL/min：27.7hr，肝機能低下者：健康成人と比較して2.3倍延長（1）未変化体24～26hr，N-脱メチル化体62～104hr（U,11）24hr（12）【透析患者のt1/2】42～96hr（Cohen LM, et al: Psychosomatics 2004 PMID: 14709759【Kel】男性0.031±0.007/hr，女性0.022±0.008/hr（1）
【蛋白結合率】98.4～98.6%（1）98%（U,11，（Cohen LM, et al: Psychosomatics 2004 PMID: 14709759）97%（12）
【Vd】5mg/kg静注時：23L/kg［ラット］（1）25L/kg（12）20L/kg［animal］（11）
【MW】342.69
【透析性】蛋白結合率が高く，Vdが大きいため透析されにくいと思われる（U,5）ほとんど除去されない（Cohen LM, et al: Psychosomatics 2004 PMID: 14709759, Schwenk MH, et al: Clin Nephrol 1995 PMID: 8529300）資料なし（1）
【薬物動態】線形性を示す（1）【O/W係数】700［1-オクタノール/水系，pH7］【pKa】8.9

【相互作用】MAO阻害剤（塩酸セレギリン）との併用で，セロトニンの分解が阻害され，脳内セロトニン濃度が高まり作用が増強すると考えられる．セレギリンを投与する場合は，14日間以上の間隔をおくこと（1）CYP2D6を阻害する（Hemeryck A, et al：Curr Drug Metab 3:13-37, 2002）が，阻害作用は弱い（Preskorn SH, et al: J Clin Psychopharmacol 27: 28-34, 2007）高用量でCYP2D6を阻害する（Spina E, et al: Clin Ther 30:1206-27, 2008）未変化体およびデスメチルセルトラリンはP-gpと親和性を有する（Wang JS, et al: Biol Pharm Bull 31: 231-4, 2008）グレープフルーツジュースによりCmaxが約1.6倍，AUCが約2倍に上昇する（Ueda N, et al: World J Biol Psychiatry 26:1-4, 2009）CYP2C9を阻害する（11）非選択的・可逆的MAO阻害作用を有するリネゾリドとの併用によりセロトニン症候群様症状の出現の可能性あり（1）トラマドール，メサドン，ペンタゾシンはセロトニン作用を有するため，セロトニン作用が増強するおそれ（1）QT延長が知られている薬剤との併用は慎重投与（1）
【更新日】20221227

※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。