

▼チャンピックス錠 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】バレニクリン酒石酸塩 (U) varenicline tartrate 【分類】 $\alpha 4 \beta 2$ ニコチン受容体部分作動薬 (禁煙補助薬)

【単位】▼0.5mg・▼1mg/錠

【常用量】第1～3日：0.5mg/日，第4～7日：1mg/日，8日～2mg/日で12週間

【用法】第1～3日：1日1回食後，4日以降：1日2回朝・夕食後

【透析患者への投与方法】設定されていない (1) が高度腎障害患者に比べ消失半減期がさらに1.5倍に延長するため，Ccr 30mL/min未満の患者への設定用量からさらに減量を要する可能性があり，慎重投与 (5)

【その他の報告】非HD日0.5mg投与中にACSを発現した症例あり (酒巻裕一，他：透析会誌 45: S833, 2012) 0.5mg/日 (FDA) 減量すれば適用可能 (佐々木真利子，他：透析会誌 44: S836, 2011)

【保存期CKD患者への投与方法】高度腎障害患者 (Ccr 30mL/min未満)：開始量：1回 0.5mg 1日1回，必要に応じ最大量を1回 0.5mg 1日2回 (1)

【その他の報告】CKD G4以上やDM合併例では減量しても副作用が発現しやすすい (牧野順子，他：第4回日本腎と薬剤研究会 2010)

Ccr 30mL/min未満では最大0.5mgを1日2回 (FDA)

高度腎障害患者では減量が必要 (Faessel HM, et al: Clin Pharmacokinetics 49: 799-816, 2010)

【特徴】ニコチン性アセチルコリン受容体 $\alpha 4 \beta 2$ の部分作動薬で，受容体に結合してニコチンの受容体結合を遮断し，ニコチン刺激によって放出されるよりも少量のドパミンを放出させ，禁煙に伴う離脱症状やタバコに対する切望感を軽減する。

【主な副作用・毒性】SJS，血管浮腫，意識障害，肝障害，精神障害，嘔気 (投与初期に嘔気が発現しやすいが，耐性を生じる)，頭痛，便秘，食欲不振，逆流性食道炎など。

【安全性に関する情報】服用者で抑うつ，不安，焦燥，興奮，行動の変化，自殺念慮，自殺などの報告あり，禁煙治療開始時にそのリスクを説明する必要がある (FDA2008年2月) またそれらの症状が現れると服用を中止する (FDA2008年5月) 悪心の発現率は女性 (40%) で男性 (24%) の約2倍であり，男女とも投与初期に多いが経時的に発現率は低下する (Ravva P, et al: Clin Pharmacol Ther 87:336-344, 2010)

【F】ほぼ完全に吸収される (1,U) 80%以上 (1)

【tmax】約3hr (1) 3～4hr (U)

【代謝】ほとんど代謝されない (1,U) P450による代謝を受けない (1) 代謝物のN-carbamoylgulucuronideはUGT2B7により生成するがKmは高い (in vitro) (Obach RS, et al: Drug Metab Dispos 34:121-30, 2006)

【排泄】尿中未変化体排泄率92% (U) 70～80% (1) 糸球体ろ過およびOCT-2を介した尿細管分泌を介して腎から排泄 (1) OCT-2の関与は相対的には大きくなく，シメチジン併用によってもAUC増加度は29%である (Feng B, et al: Clin Pharmacol Ther 83: 567-76, 2008) 排泄物のうち未変化体81%，2-水酸化体2.9%，N-カルバモイルグルクロン酸抱合体3.6% (Obach RS, et al: Drug Metab Dispos 34:121-30, 2006) 主に糸球体ろ過，一部はOCT-2による尿細管分泌により尿中に排泄される (Faessel HM, et al: Clin Pharmacokinetics 49: 799-816, 2010)

【CL/F】153±31mL/min (1)

【t1/2】単回：13～19hr，反復：24～28hr (1) 24hr (U) 17hr (Obach RS, et al: Drug Metab Dispos 34: 121-30, 2006)

【腎障害患者のt1/2】Ccr 50～80mL/min：33hr，Ccr 30～50mL/min：35hr，Ccr 30mL/min未満：56hr，HD患者：78hr (1)

【蛋白結合率】20.3% (1) 20%以下 (U)

【Vd/F】281L/man [CV：38%] (1)

【MW】361.35

【透析性】HDクリアランス210mL/min [146～244mL/min] で，3hrHDでの平均除去率は44.0% [20.5～68.7%] (1) 蛋白結合率が低く，血漿中の薬物は除去される (U) が，Vdが比較的大きいため効率的には除去できない可能性がある (5)

【O/W係数】11.5 [1-オクタノール/buffer, pH12] (1) 【pKa】9.2

【相互作用】シメチジン併用により尿細管分泌を阻害し，AUCが29%増加する (1) が，尿細管分泌における相互作用で臨床的に問題となることはないと思われる (Feng B, et al: Clin Pharmacol Ther 83: 567-76, 2008) ジゴキシンとの相互作用は認められない (Faessel HM, et al: Eur J Clin Pharmacol 64: 1101-9, 2008) 禁煙による主にCYP1A2誘導増強に伴い，その基質の血中濃度が上昇することがある (1) OCT-2を阻害するシメチジンにより腎CLが29%低下する (Feng B, et al: Clin Pharmacol Ther 83: 567-76, 2008)

【備考】12週以上は自由診療扱い。ニコチン製剤との併用は不可。生姜に鎮吐作用があるため併用する選択肢もある。

【更新日】20190914

※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。