

○シムビコートタービュヘイラー [外]

【重要度】 【一般製剤名】ブデソニド/ホルモテロールフマル酸塩 (U) budesonide/formoterol fumarate hydrate 【分類】気管支喘息治療配合剤 (CS+LABA)

【単位】▼30吸入・○60吸入/本 [ブデソニド160 μ g+ホルモテロールフマル酸塩水和物4.5 μ g吸入]

【常用量】■維持療法：1回1吸入1日2回 [最大8吸入/日：ブデソニドとして1280 μ g、ホルモテロールフマル酸塩水和物として36 μ g] ■頓用吸入 (SMART療法)：発作時に追加吸入するが、1回の発作につき最大6吸入まで (維持療法と合計すると通常8吸入/日で、一時的には12吸入/日まで可能) ■COPD：1回2吸入を1日2回

【用法】1日2回吸入

【透析患者への投与方法】常用量 (5)

【保存期CKD患者への投与方法】常用量 (5)

【特徴】吸入後、一部が側鎖の脂肪酸エステルとして気道組織に保持され、細胞内リパーゼにより可逆的に徐々にブデソニドを再生するため長時間作用する。ホルモテロールは選択的 β 2受容体刺激剤で、迅速で持続的な気管支平滑筋弛緩作用を示す。 β 2受容体刺激薬は脂溶性が高いほど作用発現が遅く、作用持続時間が長い特徴があり、ホルモテロールはその中間の性質を示し速効性と持続性の両者を併せ持つ。ホルモテロールの β 2受容体選択性は、サルメテロールの1/3。

【主な副作用・毒性】アナフィラキシー様症状、血清K低下、咽頭浮腫、発疹、嘔声、咽頭違和感、口腔カンジダ、動悸、振せん、不整脈、高血糖など。吸入後にうがいを行う。

【F】ブデソニド吸入で40%、経口投与で13% (1) 一部は嚥下されて消化管から吸収される (1) ホルモテロール：吸入で21~37% (U)

【代謝】ブデソニド：CYP3A4、ホルモテロールCYP2D6と2C (1) ホルモテロールはグルクロン酸抱合を受ける (1) ホルモテロールはCYPによる酸化的代謝とグルクロン酸抱合、O-脱メチル化、直接抱合などで代謝 (U)

【排泄】尿中回収率：ブデソニド57%、ホルモテロール62% [iv] (1) 【CL】ブデソニド1.24L/min、ホルモテロール1.4L/min [iv] (1)

【t1/2】吸入後の血中半減期ブデソニド3hr、ホルモテロール6hr (1) ホルモテロール10hr (U)

【蛋白結合率】ブデソニド90%、ホルモテロール50% (1) ホルモテロール：61~64%で、アルブミンと31~38% (U,11)

【Vd】ブデソニド3L/kg、ホルモテロール5L/kg [iv] (1)

【MW】ブデソニド430.53、ホルモテロールフマル酸塩水和物840.91

【透析性】資料なし (1)

【O/W係数】ブデソニド0.1%：540 [1-オクタノール/水系]、ホルモテロール2.6 [1-オクタノール/buffer, pH7.4] (1)

【相互作用】CYP3A4阻害剤によるブデソニドの血中濃度上昇 (1)

【備考】ホルモテロールの気管支拡張作用は (R,R)-体によるものであり、(S,S)-体には活性がない (1) 容器は水洗いしない。吸入器の中には乾燥剤が入っている。SMART療法時には他のSABAを使用しない。

【更新日】20170829

※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。