

▼レクサプロ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】 エスシタロプラム シュウ酸塩 (U) Escitalopram Oxalate 【分類】 抗うつ薬 [SSRI]

【単位】 ▼10mg/錠・▼20mg/錠

【常用量】 10mg/日 [最大 20mg, 増量には1週間以上あける]

■肝機能障害患者, 高齢者, CYP2C19 の PM 患者では血中濃度が上昇し QT 延長等の副作用が発現しやすいおそれがあるため最大 10mg/日

【用法】 1 日 1 回夕食後

【透析患者への投与方法】 高度腎障害患者には慎重投与 (1)

QT 延長作用があり, 他の SSRI と比較して心突然死のリスクが有意に高い (Assimon MM, et al: J Am Soc Nephrol 2019 PMID: 30885935)

PPI 使用中の透析患者では, セルトラリンと比較して, エスシタロプラム使用で突然死のリスクが有意に高い (Assimon MM, et al: Pharmacoepidemiol Drug Saf 2022 PMID: 35285107)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 高度腎障害患者には慎重投与 (1) ラセミ体での検討では高度腎障害患者における全身クリアランスの低下は 33%程度 (1)

【特徴】 シタロプラムの S 体, 他の SSRI と比較して, ノルアドレナリンやドパミンの取り込み阻害作用が弱く, より選択的なセロトニン取り込み阻害作用を有する。うつ病・うつ状態, 社会不安障害に適用される。

【主な副作用・毒性】 消化器症状, 痙攣, SIADH, セロトニン症候群, QT 延長, 倦怠感, 無力症, 熱感, 体重変化, 発疹, アナフィラキシー, あくび, 不眠症, 傾眠, 悪心, 頭痛, 浮動性めまい, 倦怠感, 便秘, 口渇, 腹部不快感, 下痢, 射精障害, いらいら感, 視覚異常など

【安全性に関する情報】 エスシタロプラムが関与した可能性のある尿細管障害の一例 (Adiga GU, et al: Clin Drug Investig 2006 PMID: 17163295)

【吸収】 食事の影響を受けない (1,U)

【F】 79.5% [ラセミ体] (1) 80% (U) 高齢者では AUC が 50%上昇 (U)

【tmax】 3~4hr (Rao N: Clin Pharmacokinetics 46: 281-90, 2007) CYP2C19 の EM, PM とも 4~5hr (1) 5hr (U)

【代謝】 主に CYP2C19 で代謝, CYP2D6 及び CYP3A4 も関与 (1) S-脱メチル体が主代謝物で未変化体の 1/3 の割合で存在するが活性は弱い (U, Rao N: Clin Pharmacokinetics 46: 281-90, 2007) 血漿では未変化体が多く, S-デメチル体, S-ジデメチル体に代謝されるが, ジデメチル体はほとんどの患者で検出されない (U) 主に CYP3A4 と 2C19 が関与 (U) CYP2C19*17 ホモでは血清濃度が低下して効果が不十分になるおそれ (Rudberg I, et al: Clin Pharmacol Ther 83: 322-7, 2008)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 CYP2C19 の EM 13%, PM 22% [単回, 168hr まで], EM 17.4%, PM 30.7% [反復 24hr まで] (1) 肝代謝後にグルクロン酸抱合体として尿中に排泄される (1) 未変化体として 8%, S-脱メチル体として 10%が尿中に回収 [po] (U)

【CL/F】 CYP2C19 の EM 26L/hr, PM 13.5L/hr (1) 大うつ病患者での CL/F=20.7L/hr (1) CL/F=600mL/min で腎 CL はその 7% (U) 肝障害患者では CL/F が 37%低下 (U)

【t1/2】 27~33hr (U, Rao N: Clin Pharmacokinetics 46: 281-90, 2007) 高齢者で 50%延長 (U) CYP2C19 の EM 28hr, PM 51hr (1) 腎障害患者 50hr (1) 肝障害時に 2 倍に延長 (U)

【蛋白結合率】 55.4% (1) 56% (U, Rao N: Clin Pharmacokinetics 46:281-290, 2007)

【Vd】 Vd/F=872~1053L/man (1) 大うつ病患者で 972L/man (1) 12L/kg (U) Vd/F=1100L/man (Rao N: Clin Pharmacokinetics 46:281-290, 2007) P-gp 阻害剤のベラパミル併用で脳内移行が増大し作用増強につながる可能性 (O' Brien FE, et al: Neuropsychopharmacology 38: 2209-19, 2013 PMID: 23670590)

【MW】 414.43

【透析性】 資料なし (1) Vd が大きく, 効率的には除去できないと思われる (5) シタロプラムは除去されない (Spigset O, et al: Eur J Clin Pharmacol 2000 PMID: 11214779)

【O/W 係数】 LogP=3.4 [1-オクタノール/水系] (1) 【pka】 9.5 (1) 【薬物動態】 5-HT トランスポーター占有率の半減期は 130hr 程度であり, 血中半減期より長い (1) 経口クリアランスは CYP2C19 の遺伝的多型, 年齢, Ccr, AST の影響を受ける (1)

【相互作用】 CYP2D6 を阻害 (1) MAO 阻害剤との併用禁忌 [MAOI 中止後 14 日間禁忌] (1) CYP2C19 阻害剤 [一部の PPI, チクロピジン] との併用注意 (1) 相互作用のポテンシャルは低い (Rao N: Clin Pharmacokinetics 2007 PMID: 17375980)

【備考】 傾眠の副作用があるので夕食後もしくは寝る前の服用が望ましい [臨床試験の用法が夕食後であったためそのように設定されている] (1) 粉砕投与可能 (1)

【更新日】 20220505

※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。