

▼タペンタ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 タペンタドール塩酸塩 tapentadol hydrochloride 【分類】 持続性がん疼痛治療剤 [強オピオイド]

【単位】 ▼25mg・▼50mg・▼100mg/錠 [徐放錠]

【常用量】 50～400mg/日 ■オピオイド鎮痛剤未使用では50mg/日から開始 ■オキシコドン徐放錠の5倍換算 ■増量は前回の増量から3日目以降

【用法】 1日2回

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 排泄が遅延するおそれがあり慎重投与 (1)

【その他の報告】 減量の必要はないと思われるが、グルクロン酸抱合体は蓄積傾向となる (5)

【特徴】 オピオイド μ 受容体のアゴニストでノルエピネフリン再取り込み阻害作用を併せ持つ疼痛治療剤。トラマドールよりも μ 受容体アゴニスト活性が数倍高い (Raffa RB, et al: Expert Opin Pharmacother 13: 1437-1449, 2012) 中等度から高度の疼痛を伴う各種癌における鎮痛に対して、非オピオイド鎮痛剤で治療困難な場合にのみ使用。ノルエピネフリン再取り込み阻害作用があり、神経障害性疼痛にも効果が期待できる。乱用を防止するために高い硬度の錠剤で、溶解させてもゲル化する。

【主な副作用・毒性】 アナフィラキシー、依存性、めまい、傾眠、痙攣、呼吸抑制、便秘、食欲不振など多数

【吸収】 吸収率は高いが、初回通過効果を受ける (1) 食後で Cmax が高い (1)

【F】 32% (Gohler K, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 51: 338-48, 2013) 徐放錠で 31%, 速放錠で 42% (1)

【tmax】 5.0hr [徐放錠] (1) 1.25～1.5hr [速放錠] (Terlinden R, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 32: 163-9, 2007)

【代謝】 主代謝物の glucuronide を含め、代謝物に活性はない (Terlinden R, et al: Methods Find Exp Clin Pharmacol 32: 31-8, 2010) UGT1A6, 1A9, 2B7 でグルクロン酸抱合される (1) CYP2C9・2C19・2D6 により N-脱メチル化、水酸化され、さらに抱合を受けて尿中に排泄される (1) 代謝における CYP の寄与は小さい (1) 代謝物に鎮痛活性はない (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 3% [po, 5日まで] (1, Terlinden R, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 32: 163-9, 2007) 尿中回収率 99%で抱合体 69%, 他の代謝物 27% (Terlinden R, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 32: 163-9, 2007) P-gp の基質でもなく阻害剤でもない (1)

【CL】 1531～1603mL/min [iv] (1) 1600mL/min (Gohler K, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 51: 338-48, 2013) 肝機能障害は全身 CL 低下に関連する因子 (Xu XS, et al: Clin Pharmacokinet 49: 671-82, 2010) CL/F=3479～4500mL/min [徐放錠] (1)

【t1/2】 4hr [iv] (Gohler K, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 51: 338-48, 2013) 5～6hr (1)

【蛋白結合率】 19.3～20.7% (1)

【Vd】 500L/man [iv] (Gohler K, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 51: 338-48, 2013) Vss=471L～540L/man (1)

【MW】 257.80

【透析性】 資料なし (1) Vd が大きいので効率的には除去できないと思われる (5)

【O/W 係数】 LogP=2.89 [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】 MAO 阻害剤と併用禁忌 (1) プロベネシド併用で AUC 増大 (1) 抗うつ薬でセロトニン症候群 (1) アセトアミノフェン、ナプロキセン、サリチル酸との PK 面の相互作用はほとんどない (Smit JW, et al: Pharmacotherapy 30: 25-34, 2010)

【備考】 レスキューには速放性オピオイド鎮痛剤を用いる (1) 退薬徴候が出現することがあるので連用中の急激な中止は避け、投与の必要がなくなれば漸減する (1) オキシコドン 20mg=タペンタドール 100mg。レスキューはモルヒネやオキシコドンの速放性製剤を使用する。

【更新日】 20171108

※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。