

△デザレックス錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】デスロラタジン Desloratadine 【分類】抗ヒスタミン薬

【単位】△5mg/錠

【常用量】5mg/日

【用法】1日1回■服用タイミングに指定はない■12歳未満の小児に対する安全性は確立

【透析患者への投与方法】減量の必要はないが、血中濃度上昇の可能性があり慎重投与 (1)

かゆみに5mg×3週で有効で、ガバペンチンより認容性が高い (Marquez D, et al: J Bras Nefrol 2012 PMID: 22850916)

【保存期 CKD 患者への投与方法】血中濃度が上昇するおそれがあるので慎重投与 (1) 腎機能正常者に比べ、Ccr 30mL/min/1.73m²未満でAUCが2.5倍 (1)

【その他の報告】高齢者でも減量の必要はない (Affrime M, et al: Clin Pharmacokinetics 2002 PMID: 12169042)

【特徴】ロラタジンの活性代謝物。ヒスタミン H1 受容体への高い選択性があり、投与タイミングの制限がなく、自動車の運転等への制限がない。

【主な副作用・毒性】ショック、アナフィラキシー、けいれん、痙攣、肝機能障害、傾眠、頭痛、頻脈、疲労、口腔乾燥など。

【安全性に関する情報】QT延長の可能性 (Ali AK: Value Health 18: A493-4, 2015 PMID: 26532767)

【吸収】食事の影響を受けない (Gupta S, et al: Clin Pharmacokinetics 41: S7-12, 2002 PMID: 12169041) 代謝が遅いタイプでは食事によりAUCが48%低下する (Wang T, et al: Clin Drug Investig 35: 807-13, 2015 PMID: 26446005)

【F】資料なし (1)

【tmax】1.5~2.5hr (1)

【代謝】主に3-水酸化体で代謝 (1) その他5-水酸化体、6-水酸化体が認められ、いずれもグルクロン酸抱合される (1) 3-水酸化体のグルクロン酸抱合にはUGT1A1, 1A3, 2B15が関与 (1, Ghosal A, et al: Biopharm Drug Dispos 2004 PMID: 15334623) 5-および6-水酸化体への代謝にはCYP1A1が関与 (1) 3-水酸化体の活性は未変化体の30%で、血中存在比は未変化体の60%であるため薬効への寄与はわずか (1) 半減期が110hrになるpoor metabolizerが確認 (Ramanathan R, et al: Xenobiotica 2007 PMID: 17620222) PMではAUCが2.6~6.5倍に増大 (Gupta SK, et al: J Clin Pharmacol 2007 PMID: 17906161) ヨルダン人のPMの頻度は3.2%でアジア人と同程度 (Hakooz N, et al: Biopharm Drug Dispos 2012 PMID: 22271705) 3-水酸化体はUGT2B10によるグルクロン酸抱合の後にCYP2C8が関与して生成する (Kazmi F, et al: Drug Metab Dispos 2015 PMID: 25595597) 中国人のPMの頻度は2.2% (Wang T, et al: Clin Drug Investig 2015 PMID: 26446005)

【排泄】尿中回収率40% (1) 尿中未変化体排泄率1.7% [po, 240hrまで] (1) 尿中の主要回収物は3-水酸化体のグルクロン酸抱合体と思われる (Uehara S, et al: Xenobiotica 2020 PMID: 31690163)

【CL/F】116L/hr (1)

【t1/2】19~23hr, 高齢者31hr, 肝障害60hr (1) 3-水酸化体33hr (1)

【蛋白結合率】82.8~87.2% (1)

【Vd/F】3260L/man (1)

【分布】

【MW】310.82

【透析性】除去率0.3%であり、除去されない (1)

【薬物動態】線形動態 (Gupta S, et al: Clin Pharmacokinetics 41: S1-6, 2002 PMID: 12169040) PKは性別や人種の影響を受けない (Affrime M, et al: Clin Pharmacokinetics 41: S21-8, 2002 PMID: 12169043)

【O/W係数】LogP=1.02 [1-オクタノール/リン酸buffer, pH7.0] (1)

【相互作用】CYP関連の相互作用を認めない (Barecki ME, et al: Drug Metab Dispos 29: 1173-5, 2001 PMID: 11502723) GFJの影響を受けない (Banfield C, et al: Clin Pharmacokinetics 41: 311-8, 2002 PMID: 11978146) エリスロマイシン併用によりデスロラタジンのAUCがわずかに(1.1倍)上昇するが、QT間隔には影響しない (Banfield C, et al: Clin Pharmacokinetics 41: S29-35, 2002 PMID: 12169044) ケトコナゾール併用によりデスロラタジンのCmaxが軽度(1.3倍)上昇したが、臨床的問題は生じない程度 (Banfield C, et al: Clin Pharmacokinetics 41: S37-44, 2002 PMID: 12169045) モンテルカストの吸収に影響しない (Cingi C, et al: Laryngoscope 123: 2610-4, 2013 PMID: 23918211) UGT2B10の阻害剤 (Kazmi F, et al: Drug Metab Dispos 43: 1294-302, 2015 PMID: 26135009) CYP2C8の基質でありクロピドグレルにより代謝遅延 (AUC 2.8倍) (Itkonen MK, et al: Drug Metab Dispos 47: 377-385, 2019 PMID: 30630815)

【肝障害患者への投与方法】肝障害患者でAUCが増大 (Gupta SK, et al: J Clin Pharmacol 2007 PMID: 17906161)

【妊婦・授乳婦への投薬】投与を避ける (1)

【主な臨床報告】ヒスタミンによる皮膚反応の抑制効果はセチリジンにやや劣る (Purohit A, et al: Ann Allergy Asthma Immunol 2004 PMID: 15237765) 治療量で脳内ヒスタミン H1 受容体に結合せず、眠気をもたらさない (Nakamura T, et al: Pharmacol Res Perspect 2019 PMID: 31338198)

【更新日】20240930

※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、日本国特許法並びに国際条約により保護されています。