

△プリリント錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】チカグレロル Ticagrelor 【分類】抗血小板剤

【単位】▼60mg・△90mg/錠

【常用量】■PCIが適用される急性冠症候群：初回180mg，以後維持量として1回90mgを1日2回

●アスピリンを含む抗血小板剤2剤併用療法が適切である場合で、かつ、アスピリンと併用する他の抗血小板剤の投与が困難な場合に限る

■陳旧性心筋梗塞：1回60mgを1日2回

●65歳以上，薬物療法を必要とする糖尿病，2回以上の心筋梗塞の既往，血管造影で確認された多枝病変を有する冠動脈疾患，末期でないCKDのうち1つ以上を有するOMIでアテローム血栓症の発現リスクが特に高い場合

【用法】維持量は1日2回（アスピリン81～100mgと併用）

【透析患者への投与方法】設定されていない（1）末期腎不全はASCへの適用外（1）

【その他の報告】PKからは減量の必要はない（5）

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 30mL/min未満でもPKやPDへの影響はみられず，減量の必要はない（Butler K, et al: J Clin Pharmacol 2012 PMID: 21960668）

【その他の報告】腎機能はPKに影響しない（1）Ccr 60mL/min未満で出血リスク増大の可能性（1）

末期腎不全はASCへの適用外（1）

腎機能低下により未変化体及び代謝物濃度が上昇するため低用量で抗血小板作用が得られる可能性（Franchi F, et al: Eur Heart J Cardiovasc Pharmacother 2022 PMID: 34114623）

【特徴】直接的可逆的P2Y₁₂受容体拮抗薬。アデノシン二リン酸（ADP）受容体であるP2Y₁₂受容体に対する選択的かつ可逆的な非競合拮抗薬で，ADP誘発血小板凝集を阻害。未変化体および代謝物に活性がある。通常，術前休業5日間。

【主な副作用・毒性】出血，出血傾向，アナフィラキシー，血管浮腫，掻痒，発疹，呼吸困難，消化器症状，めまい，失神，房室ブロック，徐脈，低血圧，高尿酸血症など

【安全性に関する情報】過剰投与には対症療法（1）高尿酸血症は，腎における尿酸分泌を阻害することによると思われる（1）血清尿酸値上昇は投与1日後から認められ，可逆的（Butler K, et al: Clin Pharmacol Ther 2012 PMID: 22190065）COPDや喘息のある例では薬剤性呼吸困難と関連する可能性（Belchikov YG, et al: Pharmacotherapy 2013 PMID: 23712633）

クロピドグレルよりも出血頻度が高い可能性（DiNicolantonio JJ, et al: Int J Cardiol 2013 PMID: 23907035）

【吸収】ka=0.67/hr（Li J, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 54: 666-74, 2016 PMID: 27191766）食事の影響を受けない（Teng R, et al: J Clin Pharm Ther. 37: 464-8, 2012 PMID: 21967645）

【F】FPEが大きく，36%（1）粉碎後経管投与してもFは変わらない（Teng R, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 53: 182-9, 2015 PMID: 25500486）

【tmax】未変化体2hr，活性代謝物2.5hr（1）未変化体1.3～2hr，活性代謝物1.5～3hr（Teng R, et al: Eur J Clin Pharmacol 66: 487-96, 2010 PMID: 20091161）

【代謝】CYP3A4，3A5により代謝（1）活性代謝物AR-C124910XXはCYP3A4で生成【O-脱エチル化】（1）活性代謝物のAUCは未変化体の1/3【単回投与】（Teng R, et al: Eur J Clin Pharmacol 2010 PMID: 20091161）未変化体に対して活性代謝物のCmaxは29%，AUCは40%（Teng R, et al: Drug Metab Dispos 2010 PMID: 20551239）PKにはSLCO1B1，UGT2B7，CYP3A4の遺伝子多型が関連するが，効果や安全性に関連するものは認められなかった（Varenhorst C, et al: Eur Heart J 2015 PMID: 25935875）

【排泄】尿中未変化体排泄率0.02%，尿中活性代謝物排泄率0.04%（1）尿中回収率26.5%【po】（1，Teng R, et al: Drug Metab Dispos 2010 PMID: 20551239）

【CL】14.2L/hrで肝CL律速【iv】（1）P-gpの基質（1）14L/hr（Li J, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2016 PMID: 27191766）

【t1/2】未変化体8.7hr，活性代謝物10hr（1）未変化体7～8.5hr，活性代謝物8.5～10hr（Teng R, et al: Eur J Clin Pharmacol 2010 PMID: 20091161）

【蛋白結合率】未変化体99.4%，活性代謝物99.9%（1）

【Vd】87.5L/man【iv】（1）中枢移行しない（1）

【MW】522.57

【透析性】未変化体，活性代謝物ともに除去されない（1）

【薬物動態】クロピドグレルと異なり，CYP2C19の遺伝的多型の影響を受けない（Tantray US, et al: Circ Cardiovasc Genet 2010 PMID: 21079055）日本人では活性体のAUCが1.4倍程度に上昇するが忍容性に問題はない（Teng R, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2014 PMID: 24755129）PKは年齢や性別の影響を受けるが，投与量調節が必要なほどではない（Teng R, et al: Eur J Clin Pharmacol 2012 PMID: 22367426）

【O/W係数】4.0以上【1-オクタノール水系】（1）

【相互作用】強いCYP3A4の阻害剤，誘導剤との併用禁忌（1）OAT3，OAT1を阻害（1）エチルエストラジオールのAUCを20%増大させるのみで経口避妊薬の効果への影響はない（Butler K, et al: Curr Med Res Opin 2011 PMID: 21692601）チカグレロルのAUCが増大するのでシンバスタチン40mg/日を超える併用は避けるべき（Teng R, et al: Eur J Clin Pharmacol 2013 PMID: 22922682）リファンピシンの併用は避ける（Teng R, et al: Eur J Clin Pharmacol 2013 PMID: 23093043）GFJ飲用によりAUC2倍（Holmberg MT, et al: Br J Clin Pharmacol 2013 PMID: 23126367）CYP2C9の基質であるトルブタミドとの相互作用を認めない（Teng R, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 2013 PMID: 23380426）P-gp阻害によりジゴキシンの吸収を増大させ血中濃度を上昇させる可能性があるため要注意（Teng R, et al:

Eur J Clin Pharmacol 2013 PMID: 23748750) ミダゾラムのAUCを12%低下させる (Teng R, et al: Clin Ther 2013 PMID: 23870610) シクロスポリンによりAUCが2.8倍に上昇 (Teng R, et al: Clin Drug Investig 2014 PMID: 24861133) モルヒネによりAUCが20%低下するが抗血小板作用には影響しない (Hobl EL, et al: Eur J Clin Invest 2016 PMID: 26449338)

ロスバスタチン併用で横紋筋融解症とAKIを発生した症例 (Samuel G, et al: Cureus 2017 PMID: 29104841)

【肝障害患者への投与方法】中等度以上の肝障害患者には禁忌 (1) 軽度肝障害患者では減量の必要なし (Butler K, et al: J Clin Pharmacol 2011 PMID: 20926753)

【小児CKD患者における報告】小児への使用経験なし (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦には有益性投与、授乳は避ける (1)

【主な臨床報告】ACSに対する有効性及び安全性においてクロピドグレルと差は認めない (Goto S, et al: Circ J 2015 PMID: 26376600)

【効果持続時間】血小板凝集抑制作用は2~12hr持続し、可逆的 (Teng R, et al: Eur J Clin Pharmacol 66: 487-96, 2010 PMID: 20091161)

【備考】虚血性脳卒中患者には出血リスクのため適用しない (1)

【更新日】20240831

※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。