

△イミグラン錠 [内]・▼イミグランキット皮下注 [注]、▼イミグラン点鼻液 [外]

【重要度】 【一般製剤名】スマトリプタン コハク酸塩 (U) Sumatriptan Succinate 【分類】5-HT_{1B/1D} 受容体作動型片頭痛治療剤

【単位】△50mg/錠、▼3mg/0.5mL キット皮下注、▼点鼻液 20mg/0.1mL

【常用量】■経口：1回 50mg [最大 200mg/日] [50mg で無効時には次回から 1回 100mg にできる] ■点鼻：1回 20mg [最大 40mg/日] ■皮下注：1回 3mg [最大 6mg/日]

【用法】片頭痛発作時に使用 [追加投与は前回の投与から 2 時間以上あける] [皮下注は前回投与から 1hr 以上あける]

【透析患者への投与方法】腎クリアランスは総クリアランスの 20%しか占めない (11) ため減量は必要はないと思われる (5) 【その他の報告】尿中未変化体排泄率が低いため減量の必要はない (U)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】セロトニン受容体のサブタイプである 5-HT_{1B/1D} 受容体に対して選択的に作動作用を有する片頭痛治療薬。脳動脈に多く存在する 5-HT_{1B/1D} 受容体に作用し、脳血管系に対して選択的な収縮作用を示すが、末梢血管系に対してはほとんど作用を示さないため、血圧、心拍数に影響を及ぼさずに脳動脈を収縮させる。三叉神経終末からのニューロペプチド放出を抑制することから血管周囲の炎症を軽減しているとも考えられる。点鼻液は片頭痛患者の胃うっ血、発作時の吐き気、嘔吐などによる錠剤の吸収不良と比べて利点がある。

【主な副作用・毒性】ショック・アナフィラキシー、不整脈、狭心症あるいは心筋梗塞を含む虚血性心疾患様症状、てんかん様発作、動悸、悪心、嘔吐、眠気、めまい、痛み、熱感、倦怠感、脱力感、蕁麻疹、発疹等の皮膚症状、肝機能検査値異常、一過性の血圧上昇、頻脈、徐脈、低血圧、レイノー現象、虚血性大腸炎、複視、眼振、視野狭窄、一過性の視力低下、圧迫感など。副作用の多くは経口投与後 2hr 以内に発生している (U)

【モニターすべき項目】血圧、肝機能

【吸収】食物やアルコールは吸収に影響しない。吸収遅延により複数のピークを生じることがある (11)

【F】不完全な吸収と初回通過効果により低く 15% (U) 14% (1,13) 10~26%と低く、その原因は吸収不良と初回通過効果を受けることによる (11) 皮下 100%，経口 14% (Fowler PA, et al: Eur Neurol 31: 291-4, 1991) 初回通過効果により F は 14% (Scott AK: Clin Pharmacokinetics 27: 337-44, 1994) 点鼻液は経口より吸収率が 10%高い (Fuseau E, et al: Clin Pharmacokinetics 41: 801-11, 2002)

【tmax】1.8±0.9hr (1) 35~45min (11) 1.5hr (13) 皮下注時 10 分 (Scott AK: Clin Pharmacokinetics 27: 337-44, 1994) 点鼻時 30 分以内に Cmax の 60%に到達 (Fuseau E, et al: Clin Pharmacokinetics 41: 801-11, 2002) 【Cmax】健康青年に 100mg を単回経口投与後 54ng/mL (13)

【代謝】肝代謝され代謝物は活性を示さない (1) 80%が肝代謝される (U) 主に肝臓でほとんどが代謝を受ける。主な代謝物はインドール酢酸誘導体 (U,11) MAO-A で代謝され不活性体となる (Fuseau E, et al: Clin Pharmacokinetics 41: 801-11, 2002)

【排泄】尿中未変化体排泄率 22±4% (13) 57%が代謝物として腎排泄 (尿細管分泌) されそのうち 3%が未変化体、35%がインドール酢酸代謝物、8%がインドール酢酸のグルクロン酸抱合体 (U) 38%が糞便中に排泄されそのうち 9%が未変化体、11%が代謝物 (U) 【CL】1.2L/min (11) 22±5.4mL/min/kg (13) 【腎 CL】260mL/min と高いため糸球体濾過だけでなく、能動的に尿細管から分泌されている (11) 197mL/min (1)

【t_{1/2}】2.2±0.3hr (1) α相 5min, β相：2hr, γ相 7.3hr (11) 1.0±0.3hr (13) 2.5hr (U)

【蛋白結合率】約 34% (1) 14~21% (U,11,13) 20%未満 (Scott AK: Clin Pharmacokinetics 27: 337-44, 1994)

【Vd】170L/man と高いのは血漿よりも組織に親和性が高いことを示している (11, Scott AK: Clin Pharmacokinetics 27: 337-44, 1994) 2.0±0.34L/kg (13)

【MW】413.50

【透析性】分布容積が大きいため透析では除去されにくいと考えられる (5)

【TDM のポイント】TDM の対象にならない。消失が速く、症状再発に関連している可能性 (Dechant KL, Clissold SP: Drugs 43:776-798, 1992) 活性代謝物がなく、水溶性であることはトリプタン類の中でも中枢毒性が少ないことと関連している可能性 (Dodick DW, et al: Cephalalgia 24:417-424, 2004) 【O/W 係数】LogP=0.86 [1-オクタノール水系, pH7] (1)

【併用注意】選択的セロトニン再取り込み阻害薬：セロトニン作用が増強し、脱力感、反射亢進、協調運動障害等があらわれることがある (1) クラリスロマイシンとの相互作用を認めない (Moore KH, et al: Clin Ther 24: 583-94, 2002)

【効果発現】おおよそ 30 分 (1) 点鼻 15 分, 経口 30 分, 皮下注 20 分 (U)

【更新日】20230808

※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、当院でも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。