

◎シングレア錠, ▼キブレス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 モンテルカスト ナトリウム (U) montelukast sodium 【分類】 ロイコトリエン受容体拮抗薬

【単位】 ▼5mg・◎10mg/錠

【常用量】 ■気管支喘息：10mg/日

■アレルギー性鼻炎：5～10mg/日

【用法】 1日1回寝る前 [朝に服用しても副作用が出現するわけではない]

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【PD】 好酸球性腹膜炎に対する治療に用いた小児の症例 (Forbes TA, et al: *Pediatr Nephrol* 29: 1279-82, 2014)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【特徴】 CysLT1 受容体に選択的な競合的拮抗薬で1日1回で有効な経口薬。気動炎症抑制作用もある。アレルギー性鼻炎による鼻閉、鼻汁、くしゃみに対する効果もある。

【主な副作用・毒性】 SJS, TEN, アナフィラキシー、血管浮腫、肝障害下痢、血小板減少、腹痛、嘔気、胸やけ、頭痛、好酸球増多、集中力低下、記憶障害など

【安全性に関する情報】 頭痛、うつ病、攻撃性、自殺念慮、異常行動などの中枢神経系有害作用に関連 (Haarman MG, et al: *Pharmacol Res Perspect* 2017 PMID: 28971612) 精神神経系の有害作用発現に関する警告 (FDA 2020.3.4)

【吸収】 食事による影響を受けない (1,U)

【F】 フィルムコーティング錠 58～67%, チュアブル錠 73% (1) チュアブル錠の方がBAが高い (1) 64% (U)

【tmax】 3～4hr (1) 10mg 錠で3～4hr, 5mg チュアブル錠で2～2.5hr (U)

【代謝】 主として CYP2C8, 2C9, 3A4 で代謝され、主に 2C8 が関与 [主代謝物は側鎖メチル基の水酸化およびベンジル位メチレン基の水酸化体] (1) グルクロン酸抱合により M1 に代謝される (1) CYP2C9 で生成する代謝物 M6 (36-OH 体) は未変化体と同等の活性をもつが、M1, M2, M4, M5 の活性は未変化体より弱い (1) 全身循環中代謝物濃度は2%以下 (1) CYP3A4, 2C9 で代謝される (U) 肝障害患者でも用量調節は必要ないが AUC が 40% 上昇する (1) CYP2C8 を阻害するが vivo では証明されていない (1) 肝抽出比 28% [ラット] (1) 主として CYP2C8 により代謝 (Karonen T, et al: *Br J Clin Pharmacol* 73: 257-67, 2012)

【排泄】 肝で代謝され胆汁排泄される (1) 尿中未変化体排泄率 0% (1) 0.2% 未満 (U) 腸肝循環しない (1) 胆汁・糞便 8%、腎 0.2% 以下 (U)

【CL】 46.8mL/min, 加齢により低下する (1) 45mL/min (U)

【t1/2】 4～6hr (1) 健康人 2.7～5.5hr (U) 肝障害患者：8.6±2.7hr に延長 (1)

【蛋白結合率】 99.6% (1) (U) アルブミンと AAG の両方に 99% 以上結合する (1)

【Vd】 10L/man (1) 8～11L (U)

【MW】 608.18

【透析性】 HD, PD によって除去されない (U) 蛋白結合率が高いため透析で除去されないと思われる (5) 資料なし (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象薬にならない (5)

【O/W 係数】 LogP=2.3 [1-オクタノール/リン酸 buffer, pH7] (1) 【pKa】 6.5

【相互作用】 フェノバルビタール：CYP3A4 の誘導による (1) CYP3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 などを阻害しない (1) in vitro では CYP2C8 を阻害するが、vivo では影響を認めない (1) クロピドグレルによる代謝阻害あり [AUC2 倍] (プラスグレルの影響はなし) (Itkonen MK, et al: *Clin Pharmacol Ther* 2018 PMID: 29171020)

【効果持続時間】 単回投与で 24hr (U)

【更新日】 20200725

※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。