◎セレコックス錠，○セレコキシブ錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】セレコキシブ（U）　Celecoxib　【分類】非ステロイド性消炎・鎮痛剤［COX-2 選択的阻害剤］
【単位】○100mg・◎200mg/錠
【常用量】■関節リウマチ：1 回 100～200mg を 1 日 2 回，朝・夕食後
■変形性関節症等：1 回 100mg を 1 日 2 回，朝・夕食後
■術後，抜歯後：初回 400mg，2 回目以降は 1 回 200mg，1 日 2 回
【用法】1 日 2 回朝・夕食後
【透析患者への投与方法】常用量（5）
【保存期 CKD 患者への投与方法】GFR 30mL/min 未満：データが少なく，腎毒性，消化器毒性のためできれば避ける．必要なら低用量から開始して注意してモニター（17）
【その他の報告】軽度腎障害患者は CL/F の 47%上昇により，健常人と比べ AUC が 43%低下（Davies NM, et al: Clin Pharmacokinet 2000 PMID: 10749518）
【特徴】コキシブ系 COX-2 選択性の NSAID．消化管及び血小板に対する影響は既存の NSAID よりも少ない［ラット］.
【主な副作用・毒性】腹痛，口内炎，発疹，下痢，嘔気，ショック，アナフィラキシー，間質性肺炎，消化性潰瘍，心筋梗塞，脳卒中，心不全，肝機能障害，再生不良性貧血など
【安全性に関する情報】高齢女性で AUC が増大（1）120 日以上の長期投与では従来の NSAIDs よりも消化管出血が有意に少ないが，心血管および腎障害のリスクはむしろ高かった（Shin S: J Pain Re 2018 PMID: 30588073）クロピドグレル併用による脳出血発現の症例（Fisher AA, et al: Ann Pharmacother 2001 PMID: 11793622）
【吸収】Ka 1.62±0.275/hr，速やかに吸収される（U）食事による AUC への影響は小さい（Paulson SK, et al: J Pharmacol Exp Ther 297: 638-5,2001）
【F】ヒトでのデータなし（1）
【tmax】2.0～2.2hr，腎障害患者 5.40±4.65hr（1）3hr（U）4～5hr（Davies NM, et al: Clin Pharmacokinet 38: 225-42, 2000）溶液の場合 1hr，カプセルの場合 2～3hr で，崩壊が律速段階となっている可能性がある（Paulson SK, et al: J Pharmacol Exp Ther 297: 638-45,2001）
【代謝】主として CYP2C9 が関与，3A4 も関与する可能性あり（1）CYP2C9 により不活性代謝物に変換（U）酸化的代謝によってメチル基が水酸化され，さらにカルボン酸体に代謝される［ラット］（Paulson SK, et al: Drug Metab Dispos 28 :514-21, 2000）CYP2C9 の PM では AUC が増大する［特に CYP2C9*3 の影響が大きい］（Tang C, et al:　Pharmacogenetics 11: 223-35, 2001）加齢や CYP2C9 の遺伝的多型の AUC への影響は小さく，CYP2C9 以外にも代謝に関与する酵素が存在する可能性がある（Brenner SS, et al: Clin Pharmacokinet 42: 283-92, 2003）
【排泄】尿中未変化体排泄率 3%未満（1,U）2%（Davies NM, et al: Clin Pharmacokinet 38: 225-42, 2000）尿中排泄率 27%で，大部分は代謝物として糞便中あるいは尿中に排泄される（1,U）尿中排泄物の大部分はカルボン酸代謝物（Paulson SK, et al: Drug Metab Dispos 28: 308-14, 2000）
【CL】21.2±0.551L/hr［po］（1）
【t1/2】5.3～9.2hr，腎障害患者 13.10±6.79hr（1）11hr（U）
【蛋白結合率】約 97%（1,U）97.4%（Paulson SK, et al: Biopharm Drug Dispos 20:293-299, 1999）
【Vd】Vd/F=335±33.5L/man（1）455±166L/man（Davies NM, et al: Clin Pharmacokinet 38:225-242, 2000）
【MW】381.37
【透析性】透析されないと思われる（U）資料なし（1）
【O/W 係数】10000 以上［1-オクタノール/水系，pH7.0］（1）【pKa】11.1
【相互作用】vitro では CYP1A2 を阻害するが，vivo では阻害しない（Karjalainen MJ, et al: Eur J Clin Pharmacol 54: 511-9, 2008）リファンピシン併用によりクリアランス増大（Jayasagar G, et al: Drug Metabol Drug Interact 2003 PMID: 14768975）フルコナゾールの CYP2C9 阻害の影響を受けるため，セレコキシブを低用量から開始（1）酸化 Mg との併用により血中濃度低下（1）アスピリンの抗血小板作用には影響しない（Gladding PA, et al: Am J Cardiol 2008 PMID: 18359332）P-gp の基質でもなく，阻害剤でもない（de Vries EF, et al: Nucl Med Biol 35: 459-66, 2008）MRP4/MRP5 の発現を誘導するので，その基質との併用には注意［vitro］（Gradilone A, et al: Curr Cancer Drug Targets 2008 PMID: 18690847）CYP2D6 を阻害してメトプロロールの AUC を増大させる（Werner U, et al: Clin Pharmacol Ther 2003 PMID: 12891223）
【小児における報告】6.9～16.2 歳の小児に 250mg/m^2 を 12hr 毎投与した際の PK 解析（Stempak D, et al: Clin Pharmacol Ther 72: 490-7, 2002）CYP2C9 の PM では血中濃度が上昇するため副作用に注意（Stempak D, et al: Clin Pharmacol Ther 78: 309-10, 2005　［letter］）
【備考】セレコキシブ単独は，ジクロフェナク＋オペプラゾール併用よりも消化管出血や消化管由来の貧血のリスクが低い（Chan FKL, et al: Lancet 9736: 173-9, 2010）
【更新日】20241010

※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。