

▼アマージ錠 [内]

【重要度】★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】ナラトリプタン塩酸塩 (U) Naratriptan Hydrochloride 【分類】5-HT_{1B/1D} 受容体作動型片頭痛治療薬

【単位】▼2.5mg/錠

【常用量】2.5mgを頭痛発現時に投与、効果不十分な場合には4hr以上あけて2.5mgを追加投与 [最大5mg/日で、無効時にお追加投与しない]

【用法】頭痛発現時に投与し、予防投与は行わない

【透析患者への投与方法】重度の腎障害患者には禁忌 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】腎障害があれば最大2.5mg/日、重度の腎障害患者には禁忌 (1)

【その他の報告】データなし (17) Cr 15mL/min 未満には禁忌 (FDA)

【特徴】頭蓋血管平滑筋に存在する5-HT_{1B} 受容体、頭蓋血管周囲の三叉神経終末に存在する5-HT_{1D} 受容体に対して選択的に作用し、片頭痛の発生機序である頭蓋血管の拡張、三叉神経の活性化及びそれともなう頭蓋血管透過性亢進を抑制することにより片頭痛を改善すると考えられる。スマトリプタンよりも作用時間が長いことが特徴と思われる (Gobel H, et al: Clin Ther 22: 981-9, 2000)

【主な副作用・毒性】悪心・嘔吐、ショック、心筋虚血症状、発疹、虚血性大腸炎、圧迫感、眠気、めまいなど

【安全性に関する情報】過量投与による症状は頭部ふらふら感、頸部緊張、疲労、協調運動障害、血圧上昇など (1)

【吸収】食事の影響を受けない (1,U) 吸収率 80% (1)

【F】70% (1,U) 74% (Jhee SS, et al: Clin Pharmacokinet 40:189-205, 2001)

【tmax】2hr (1) 2~3hr, 発作時 3~4hr (U)

【代謝】CYP1A2, 2C9, 2D6, 2E1, 3A4/5 など複数のCYP分子種でN酸化体及びピペリジノン体へ代謝されるが、クリアランスにおける代謝の寄与は低い (1) 代謝物に活性はない (1) CYPで代謝を受け、不活性体に変換 (U)

【排泄】尿中未変化体排泄率約50% [po, 24hr まで] 尿中回収率 77.0% [po, 96hr まで] で主に未変化体 (1) 尿中に未変化体として50%、代謝物として30%排泄 (U)

【CL/F】511±213mL/min (1) 36.1L/hr (1) 【腎 CL】173.7±78.4mL/min (1)

【t_{1/2}】5~6hr (1) 6hr (U) CLCr40~75mL/min : 12.1±4.2hr, CLCr 15~39mL/min : 11.3±3.7hr (1) 【ke】0.149±0.043/hr (1)

【蛋白結合率】29% (1) 28~31% (U)

【Vd/F】427.26L/man (1) 脳内移行性は低い (1)

【MW】371.93

【透析性】資料なし (1) 透析されるが、Vdが大きいため効率的ではないと思われる (5)

【O/W 係数】logP=1.95 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】9.7 (1)

【薬物動態】線形で、女性でAUCが増大する傾向 (1)

【相互作用】SSRI/SNRI 併用下でセロトニン症候群のおそれ (1)

【更新日】20240702

※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。