

▼ストラテラカプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】アトモキセチン塩酸塩 (U) Atomoxetine Hydrochloride 【分類】注意欠陥/多動性障害治療剤 (選択的ノルアドレナリン再取り込み阻害剤)

【単位】▼5mg・▼10mg・▼25mg・▼40mg/Cap

【常用量】0.5mg/kg/日より開始, 0.8mg/kg/日→1.2mg/kg/日に増量し, 1.2~1.8mg/kg/日を維持量とする。[最大120mg/日]

【用法】1日2回

【透析患者への投与方法】尿中排泄率が低く減量の必要はないと思われる (5)

【保存期CKD患者への投与方法】尿中排泄率が低く減量の必要はないと思われる (5)

【特徴】選択的ノルアドレナリン再取り込み阻害剤。前頭葉でのドーパミン濃度上昇も効果に関与していると推測されている。

【主な副作用・毒性】アナフィラキシー, 肝障害, 皮膚炎, 多汗症, 消化器症状, 頭痛, 攻撃性, 動悸, 心拍数上昇, 血圧上昇, 胸部不快感など

【F】63~94%で初回通過効果により変化 (Sauer JM, et al: Clin Pharmacokinetics 44:571-590, 2005) EM 63%, PM 94% (1)

【tmax】1~2hr [小児] (Witcher JW, et al: J Child Adolesc Psychopharmacol 13:53-63, 2003)

【代謝】肝でCYP2D6により主代謝物4-OH体に, CYP2C19によりマイナー代謝物N-脱メチル体に変換される (Ring BJ, et al: Drug Metab Dispos 30:319-323, 2002) CYP2D6のPMでも4-OH体は生成する (Ring BJ, et al: Drug Metab Dispos 30:319-323, 2002) 4-OH体はさらにグルクロン酸抱合され, EMでは4-OH-グルクロン酸抱合体が, PMでは主としてN-脱メチル体が血中に主に存在する (Sauer JM, et al: Drug Metab Dispos 31:98-107, 2003) CYP2D6のPMではAUCが10倍, Cmaxが5倍増大する (U) 4-OH体はノルエピネフリントランスポーター阻害に関して未変化体と同等の活性を有するが, 血中での存在比は小さい [EMで1%, PMで0.1%] (U) CYP2C19により生成するN-脱メチル体の活性は低く, 血中存在比も少ない (U)

【排泄】尿中未変化体排泄率3% (U) 4-OH体のグルクロン酸抱合体として尿中に排泄される (Sauer JM, et al: Clin Pharmacokinetics 44:571-590, 2005) 80%以上が4-OH体のグルクロン酸抱合体として尿中に回収 (U)

【CL】CYP2D6のEM 0.35L/hr/kg, PM 0.03L/hr/kg (Sauer JM, et al: Clin Pharmacokinetics 44: 571-590, 2005)

【t1/2】CYP2D6のEM 5hr, PM 20hr (U, Sauer JM, et al: Drug Metab Dispos 31: 98-107, 2003) 約3hr [EM小児] (Witcher JW, et al: J Child Adolesc Psychopharmacol 13:53-63, 2003)

【蛋白結合率】99% (Sauer JM, et al: Clin Pharmacokinetics 44:571-590, 2005) 98% [アルブミンと結合] (U) 98~99% (1)

【Vd】水溶性が高く0.85L/kg (1,U, Sauer JM, et al: Clin Pharmacokinetics 44:571-590, 2005) 体水分量に近似 (U) PMで0.91L/kg (1)

【MW】291.82

【透析性】資料なし (1) PBRが高く, 透析性は低いと思われる (5)

【O/W係数】

【薬物動態】血漿濃度は脳内濃度と相関し, 唾液でのTDMも可能かもしれない (Alsmadi MM, et al: CNS Neurol Disord Drug Targets 2022 PMID: 35043773)

【相互作用】CYP2D6を阻害するパロキセチン併用により, 未変化体のCmaxが3.5倍, AUCが6.5倍, t1/2を2.5倍になり, 2D6のPMと類似したPKをとる (Belle DJ, et al: J Clin Pharmacol 42:1219-1227, 2002) アトモキセチンのCYP2D6, 3A4阻害による相互作用は軽微である (Sauer JM, et al: J Pharmacol Exp Ther 308:410-418, 2004) CYP2D6のPMでは2D6阻害剤の影響を受けにくい (Sauer JM, et al: Clin Pharmacokinetics 44:571-590, 2005) デキストロメトर्फアンのCYP2D6による代謝を競合的に阻害する (Cicone PE, et al: J Am Pharm Assoc 46:472-478, 2006)

【肝障害患者への投与方法】肝障害患者ではAUCが約2倍に増加するので, 肝障害の程度に応じた減量が必要であり, 中等度肝障害時には50%に, 高度腎障害時には25%に減量すべき (Chalon SA, et al: Clin Pharmacol Ther 73 178-91, 2003)

【備考】内用液は希釈しない

【更新日】20231005

※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。