

## ▼レクサプロ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】 エスシタロプラム シュウ酸塩 (U) Escitalopram Oxalate 【分類】 抗うつ薬 [SSRI]

【単位】 ▼10mg/錠・▼20mg/錠

【常用量】 10mg/日 [最大 20mg, 増量には1週間以上あける]

■肝機能障害患者、高齢者、CYP2C19のPM患者では血中濃度が上昇しQT延長等の副作用が発現しやすいおそれがあるため最大10mg/日

【用法】 1日1回夕食後

【透析患者への投与方法】 高度腎障害患者には慎重投与 (1)

QT延長作用があり、他のSSRIと比較して心突然死のリスクが有意に高い (Assimon MM, et al: J Am Soc Nephrol 2019 PMID: 30885935)

PPI使用中の透析患者では、セルトラリンと比較して、エスシタロプラム使用で突然死のリスクが有意に高い (Assimon MM, et al: Pharmacoepidemiol Drug Saf 2022 PMID: 35285107)

【保存期CKD患者への投与方法】 高度腎障害患者には慎重投与 (1) ラセミ体での検討では高度腎障害患者における全身クリアランスの低下は33%程度 (1)

【特徴】 シタロプラムのS体、他のSSRIと比較して、ノルアドレナリンやドパミンの取り込み阻害作用が弱く、より選択的なセロトニン取り込み阻害作用を有する。うつ病・うつ状態、社会不安障害に適用される。

【主な副作用・毒性】 消化器症状、痙攣、SIADH、セロトニン症候群、QT延長、倦怠感、無力症、熱感、体重変化、発疹、アナフィラキシー、あくび、不眠症、傾眠、悪心、頭痛、浮動性めまい、倦怠感、便秘、口渇、腹部不快感、下痢、射精障害、いらいら感、視覚異常など

【安全性に関する情報】 エスシタロプラムが関与した可能性のある尿管障害の一例 (Adiga GU, et al: Clin Drug Investig 2006 PMID: 17163295) 透析患者におけるQT延長に関するSSRIの関与 (Assimon MM, et al: J Am Soc Nephrol 2019 PMID: 30885935)

【吸収】 食事の影響を受けない (1,U)

【F】 79.5% [ラセミ体] (1) 80% (U) 高齢者ではAUCが50%上昇 (U)

【tmax】 3~4hr (Rao N: Clin Pharmacokinetics 46: 281-90, 2007) CYP2C19のEM, PMとも4~5hr (1) 5hr (U)

【代謝】 主にCYP2C19で代謝、CYP2D6及びCYP3A4も関与 (1) S-脱メチル体が主代謝物で未変化体の1/3の割合で存在するが活性は弱い (U, Rao N: Clin Pharmacokinetics 46: 281-90, 2007) 血漿では未変化体が多く、S-デメチル体、S-ジデメチル体に代謝されるが、ジデメチル体はほとんどの患者で検出されない (U) 主にCYP3A4と2C19が関与 (U) CYP2C19\*17ホモでは血清濃度が低下して効果が不十分になるおそれ (Rudberg I, et al: Clin Pharmacol Ther 83: 322-7, 2008)

【排泄】 尿中未変化体排泄率CYP2C19のEM 13%, PM 22% [単回, 168hrまで], EM 17.4%, PM 30.7% [反復24hrまで] (1) 肝代謝後にグルクロン酸抱合体として尿中に排泄される (1) 未変化体として8%, S-脱メチル体として10%が尿中に回収 [po] (U)

【CL/F】 CYP2C19のEM 26L/hr, PM 13.5L/hr (1) 大うつ病患者でのCL/F=20.7L/hr (1) CL/F=600mL/minで腎CLはその7% (U) 肝障害患者ではCL/Fが37%低下 (U)

【t1/2】 27~33hr (U, Rao N: Clin Pharmacokinetics 46: 281-90, 2007) 高齢者で50%延長 (U) CYP2C19のEM 28hr, PM 51hr (1) 腎障害患者50hr (1) 肝障害時に2倍に延長 (U)

【蛋白結合率】 55.4% (1) 56% (U, Rao N: Clin Pharmacokinetics 46:281-290, 2007)

【Vd】 Vd/F=872~1053L/man (1) 大うつ病患者で972L/man (1) 12L/kg (U) Vd/F=1100L/man (Rao N: Clin Pharmacokinetics 46:281-290, 2007) P-gp阻害剤のベラパミル併用で脳内移行が増大し作用増強につながる可能性 (O' Brien FE, et al: Neuropsychopharmacology 38: 2209-19, 2013 PMID: 23670590)

【MW】 414.43

【透析性】 資料なし (1) Vdが大きく、効率的には除去できないと思われる (5) シタロプラムは除去されない (Spigset O, et al: Eur J Clin Pharmacol 2000 PMID: 11214779)

【O/W係数】 LogP=3.4 [1-オクタノール水系] (1) 【pka】 9.5 (1) 【薬物動態】 5-HTトランスポーター占有率の半減期は130hr程度であり、血中半減期より長い (1) 経口クリアランスはCYP2C19の遺伝的多型、年齢、Ccr、ASTの影響を受ける (1)

【相互作用】 CYP2D6を阻害 (1) MAO阻害剤との併用禁忌 [MAOI中止後14日間禁忌] (1) CYP2C19阻害剤 [一部のPPI, チクロピジン] との併用注意 (1) 相互作用のポテンシャルは低い (Rao N: Clin Pharmacokinetics 2007 PMID: 17375980)

【備考】 傾眠の副作用があるので夕食後もしくは寝る前の服用が望ましい [臨床試験の用法が夕食後であったためそのように設定されている] (1) 粉砕投与可能 (1)

【更新日】 20230502

※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。