

▼エクリラ ジェヌエア吸入用 [外]

【重要度】 【一般製剤名】 アクリジニウム臭化物 acridinium bromide 【分類】 吸入気管支拡張剤 [LAMA]

【単位】 ▼400 μ g吸入 [30吸入 (15日分)]

【常用量】 1回1吸入 [400 μ g], 1日2回

【用法】 1日2回吸入

【透析患者への投与方法】 常用量 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 常用量 (1)

【その他の報告】 PKは有意に変化せず減量の必要なし (Schmid K, et al: Clin Ther 32: 1798-812, 2010 PMID: 21194604)

高齢者でも常用量で可 (de la Motte S, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 50: 403-12, 2012 PMID: 22541745)

【特徴】 COPD のコントローラーとして使用される長時間作用型の M3 受容体に親和性を有する抗コリン剤。音と信号により正しく吸入できたことを確認できるジェヌエア吸入デバイス。内容物は白色のドライパウダー

【主な副作用・毒性】 心房細動, 不整脈, 発声障害, 口腔咽頭不快感, 咳嗽, 鼻咽頭炎, 副鼻腔炎, 鼻炎, 下痢, 嘔吐, めまい, 発疹, 霧視, 転倒, 尿閉, 過敏症, 血管浮腫など

【安全性に関する情報】 従来薬に比べて抗コリン性副作用が軽度である可能性 (Alagha K, et al: Ther Adv Respir Dis 5: 19-28, 2011 PMID: 20884687) QTを延長させない (Lasseter KC, et al: J Clin Pharmacol 51: 923-32, 2011 PMID: 20959525)

【F】 4.37% [吸入] (1) 血中濃度はほぼ検出限界以下である (Jansat JM, et al: J Clin Pharmacol 49: 1239-46, 2009 PMID: 19592595)

【tmax】 5~24min [吸入] (1)

【代謝】 エステル結合が非酵素的に加水分解されアルコール代謝物及びカルボン酸代謝物に変換され, 更に水酸化, 還元などにより代謝されて排泄 (1) 代謝物に活性はない (1) 速やかにアルコール, カルボン酸代謝物に変換され, 3時間後には血中に検出されない (Jansat JM, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 47: 460-8, 2009 PMID: 19640353) CYPは関与せず, コリンエステラーゼを競合阻害 (Alberti J, et al: Drug Metab Dispos 38: 1202-10, 2009 PMID: 20332199)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1% [iv], 0.09% [吸入], 尿中回収率 65% [iv], アルコール代謝物として 6.81% [吸入], カルボン酸代謝物として 17.37% [吸入] (1) 尿中回収率はわずかで不活性代謝物の方が未変化体より多い (Ortiz S, et al: J Clin Pharmacol 52: 819-27, 2012 PMID: 21628603) 尿中未変化体排泄率 1%で尿中回収率 65% [iv] (Ortiz S, et al: Biopharm Drug Dispos 33: 39-45, 2012 PMID: 22275272)

【CL/F】 881 \pm 228L/hr (1) アクリジニウム臭化物及びアルコール代謝物は P-gp の基質 (1)

【t1/2】 単回 4.9hr, 反復 13.6hr (1)

【蛋白結合率】 未変化体は速やかに分解されるため測定できない (1) アルコール代謝物 15%, カルボン酸代謝物 87% (1)

【Vd】 95~302L/man [iv] (1)

【MW】 564.56

【透析性】 資料なし (1) 未変化体の透析性は考慮しなくてよい (5) 代謝物のうちアルコール体の除去率は高く, カルボン酸体は一部除去されると思われる (5)

【薬物動態】 反復吸入にても蓄積性を認めない (Lasseter K, et al: Pulm Pharmacol Ther 25: 193-9, 2012 PMID: 22366196)

【O/W 係数】 LogP=1.9 (1)

【肝障害患者への投与方法】 肝障害時にも減量の必要はない (1)

【主な臨床報告】 チオトロピウムと効果は同等以上 (Beier J, et al: COPD 10: 511-22, 2013 PMID: 23819698)

【更新日】 20180410

※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。