

▼ルパフィン錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】ルパタジン フマル酸塩 Rupatadine Fumarate 【分類】抗ヒスタミン薬 [第2世代]

【単位】▼10mg/錠

【常用量】1回10mg, 1日1回 [最大1回20mg]

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】血中濃度が上昇するおそれがあるので慎重投与 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】血中濃度が上昇するおそれがあるので慎重投与 (1)

【特徴】三環系 H1 受容体拮抗薬。アレルギー性鼻炎、蕁麻疹、皮膚疾患によるそう痒に適用。血小板活性化因子 (PAF) 受容体への拮抗作用が特徴で、血管拡張や血管透過性の亢進による症状が強い例に良い適用と思われる。代謝物にも活性がありデスロラタジン (デザレックス) である。デザレックスと異なり自動車運転禁止となる。

【主な副作用・毒性】ショック、てんかん、痙攣、肝障害、眠気、倦怠感、頭痛、浮腫、口渇、消化器症状など

【安全性に関する情報】自動車運転禁止 (1) QT 延長に関与しない (Donado E, et al: Br J Clin Pharmacol 2010 PMID: 20406224, Taubel J, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2018 PMID: 28763575) 中枢神経抑制作用は観察されなかった (Taubel J, et al: PLoS One 2016 PMID: 27632557)

【吸収】食後投与で AUC が 1.3 倍増大するが臨床的には問題にならない (Solans A, et al: Clin Ther 29: 900-8, 2007 PMID: 17697908) 34.6%が吸収される (1) 尿中回収率から 1/3 は吸収されると推定 (1)

【F】ルパタジンとして 2.3% [未変化体としての F であることに注意] (1)

【tmax】1hr (1)

【代謝】主代謝物デスロラタジン (活性あり) となり、さらに代謝されるが複数の活性代謝物が存在 [3-水酸化体, 5-水酸化体, 6-水酸化体] (1) 主として CYP3A4 で代謝され、2D6, 2C9, 2C19 も一部関与 (1) CYP3A5, MDR1 多型が薬物動態個人差に関与 (Xiong Y, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokin 2016 PMID: 25427746)

【排泄】尿中未変化体排泄率 1%未満 [ルパタジンとして] (1) 尿中回収率 20% (1)

【CL/F】ルパタジンとして 1035L/hr [po] (1)

【t1/2】未変化体 4~8hr, デスロラタジン 20~30hr (1)

未変化体 ke=0.1485/hr (1)

【蛋白結合率】98~99% (1)

【Vd/F】7567L/man [po] (1)

【MW】532.03 [フマル酸塩]

【透析性】資料なし (1) デスロラタジンは除去されない (5)

【薬物動態】40mg まで線形 (Taubel J, et al: PLoS One 2016 PMID: 27632557) 1日1回投与で有効 (Pena J, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokin 2008 PMID: 18777946)

【O/W 係数】0.8 [1-オクタノール水系] (1)

【相互作用】CYP3A4 阻害剤により血中濃度は未変化体は上昇、デスロラタジンは低下もしくは不変 (1)

【妊婦・授乳婦への投薬】妊婦には投与を避け、授乳中止 (1)

【主な臨床報告】

【備考】アレルギー皮膚内反応検査を実施する 3~5 日前より中止 (1) AUC からみて本剤 20mg はデザレックス 5mg 相当である (5)

【更新日】20240930

※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。