

○ラミシール錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】テルビナフィン塩酸塩 (U) Terbinafine Hydrochloride 【分類】アリルアミン系抗真菌剤

【単位】○125mg/錠

【常用量】125mg/日

【用法】1日1回食後 [外用抗真菌剤で治療可能な患者には使用しない]

【透析患者への投与方法】未変化体尿中排泄率が低いいため減量する必要はない (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】未変化体尿中排泄率が低いいため減量する必要はない (5) 【その他の報告】腎障害のある患者では高い血中濃度が持続するおそれがあるため慎重投与 (1) Ccr 50mL/min 未満の患者では全身 CL が 50%に低下する (FDA) Ccr 50mL/min 以下ではデータがないので投与しないことを推奨 (サンフォード感染症治療ガイド)

【特徴】アリルアミン系骨格を有する抗真菌剤で、皮膚糸状菌 (白癬菌) に対して強力な殺真菌作用を有する。爪や皮膚への移行性が高い。従来のアゾール系の抗真菌剤と異なりスクアレネボキシダーゼを選択的に阻害してスクアレンの蓄積並びにエルゴステロール含量の低下をもたらす抗真菌作用を示す。CYP2D6 阻害作用を有し消失半減期が長いため要注意。

【主な副作用・毒性】重篤な肝障害 (投与開始2ヶ月以内におこりやすいため、投与開始2ヶ月間は月1回の肝機能検査を実施)、横紋筋融解症、血球減少、SJS、TEN、関節痛、筋肉痛、胃部不快感、腹痛、発疹、蕁麻疹、搔痒感、肝障害、貧血、消化器症状、舌炎、頭痛、ふらつき、眠気、味覚異常、倦怠感、光線過敏性皮膚炎など

【モニターすべき項目】肝機能検査

【吸収率】速やかに吸収され食物の影響も受けない (U) 食事摂取の影響なし (11)

【F】70~80% (U) 70% (1)

【tmax】2.2±0.3hr (1,11) 2hr (U)

【代謝】肝代謝 (1) 血漿中の主代謝産物はカルボン酸体及びN-脱メチルカルボン酸体、また尿中主代謝産物は脱N-メチルカルボン酸体であり、未変化体は検出されなかった。In vitro の試験において、CYP2C9、CYP1A2、CYP3A4、CYP2C8、CYP2C19、によって代謝される。N-脱メチル体および水酸化体が極めて弱い抗真菌活性を示すのみで、他の代謝物はほとんど活性を示さない。また CYP2D6 の強力な阻害剤である (1) 15 種類の代謝物が確認されているが代謝物に活性はない (U) 主として CYP2C9、1A2、3A4 で代謝される (Vickers AEM, et al: Drug Metab Dispos 27:1029, 1999)

【排泄】尿中に未変化体は排泄されない (1) 尿中約 80%、糞中約 20%回収 (1,U) 【CL】0.95±0.20 L/hr/kg (1)

【t1/2】39.9±7.1hr (1) 11~17hr (11) 血漿 t1/2α 0.8hr、血漿 t1/2β 11~170hr、t1/2terminal 22 日 (脂肪組織からの再分布のため)、皮脂 t1/2β 3~5 日、毛髪・爪 t1/2terminal 24hr、皮膚 t1/2terminal 28 日、血漿濃度が定常状態に達するのに 10~14 日必要 (U)

【蛋白結合率】99.6% (1) 99% (U)

【Vd】25±5L/kg (1) 1000L/man (11) 948L/man (U) 【分布】皮膚の薄層・皮脂・髪・爪に分布するが、汗では検出されない (11) 真皮、表皮にも分布し、皮脂や頭皮、爪にも治療数週間で分布する。脂肪組織にも高濃度で分布し、血球にも投与量の 8%が分布する (U)

【MW】327.90

【透析性】資料なし (1) 蛋白結合率が高く Vd も非常に大きいことから透析だけでなくあらゆる血液浄化療法によっても除去されないと思われる (5)

【TDM のポイント】TDM の対象にならない 【O/W 係数】高い (11) 10 [1-オクタノール水系] (1) 【pKa】7.13 (1)

【相互作用】CYP2D6 阻害剤 [IR 0.92] であるため 3 環系抗うつ薬やデキストロメトルフエンなど、2D6 を介する相互作用に注意 (1) シメチジン・フルコナゾール [本剤の血中濃度が上昇]、リファンピシン [本剤の血中濃度が低下]、黄体・卵巣ホルモン混合製剤 [月経異常] (1) シクロスポリンの血中濃度低下 (1)

【更新日】20230608

※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。