

## ▼ケテック錠 [内] &lt;販売中止&gt;

【重要度】★★ 【一般製剤名】テリスロマイシン (TEL) (U) telithromycin 【分類】ケトライド系経口抗菌剤

【単位】▼300mg/錠

【常用量】600mg/日

【用法】1日1回5日間■歯周組織炎、歯冠周囲炎及び顎炎：3日間■肺炎には最大7日間

【透析患者への投与方法】HD日に600mgをHD後に投与し、HD日以外には1日1回300mgへの減量を考慮(1)【その他の報告】HD後2hr以上経過後に投与すると健康成人とのCmax, AUCに有意差なし(1)

【保存期腎不全患者への投与方法】Ccr 30mL/min未満：1日1回300mgへの減量を考慮(1)【その他の報告】Ccr 30mL/min未満：600mgを24hrごと【常用量は800mg】(サンフォード感染症治療ガイド) 高度の腎機能障害患者(CCr<30mL/min)におけるCmax及びAUCは健康成人に比べて有意に増加し、それぞれ健康成人の約1.5及び2.0倍(1) 腎不全時における経口でのAUC増加は吸収の増大(初回通過効果の低下)によるものと推測(5)

【特徴】14員環ラク톤の8位にケトン基を有するケトライド系抗菌剤。マクロライド、ペニシリン耐性肺炎球菌に対する抗菌力が増強。細菌の70Sリボソームの50Sサブユニット中の23S rRNAドメインVの2058位及び2059位アデニン残基に加えて、ドメインIIの752位アデニン残基に結合し、蛋白合成を阻害する。濃度依存性の抗菌特性を示す。

【主な副作用・毒性】下痢、軟便、肝機能異常、頭痛、腹部膨満、嘔気・悪心、ショック、アナフィラキシー様症状、重症筋無力症の悪化、意識消失、肝機能障害、黄疸など

【吸収】食事の影響を受けない(1)

【F】初回通過効果を受け約57%(1, U, Perret C, et al: Chemotherapy 48: 217-223, 2002)

【tmax】2.5hr (1) 1hr (U)

【代謝】主要な代謝物として脱芳香環体、その他の代謝物として脱メチル体、オキサイド体、脱芳香環体酸化物が確認される(1) CYP3A4, 1Aが関与(1) 主要代謝物としてRU 76363がある(Perret C, et al: Chemotherapy 48: 217-223, 2002) 主代謝物のAUCは未変化体の12.6%(U)

【排泄】経口投与後の尿中未変化体排泄率12%のため(1) Fで補正した尿中未変化体排泄率は21%(5) 13%(U, 12) 7%が未変化体として胆汁排泄(U) 尿中回収率17.4% [po, 7日まで](1) 【CL】61.3±10.5L/hr [iv](1) 腎CL14L/hr, 肝CL40L/hr (1) 【腎CL/総CL】30%以下(U) 35%(1)

【t1/2】9.6hr (1) 10hr (U) α相：2.87hr、β相：9.81hr (Namour F, et al: Antimicrob Agents Chemother 45:170-175, 2001) 9.8hr (12)

【蛋白結合率】約60~70%(12, U, 山崎浩子, 他：日本化学療法学会雑誌 51:206, 2003) 50~70%(1)

【Vd】2.9L/kg [iv] (1, 12, U)

【MW】812.00

【透析性】Vdがやや大きいため効率的には除去できないと思われる(5) HD後2hr以上経過後に投与するとPKは健康人と同等(1)

【O/W係数】LogP=1.6 [1-オクタノール水系, pH7.0] アルカリ性側で油層に分配(1)

【相互作用】CYP3A4及び軽度にCYP2D6を阻害(1)

【更新日】20170509

※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。