

## ▼ナボバンカプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】 トロピセトロン塩酸塩 tropisetron hydrochloride

【分類】 5-HT<sub>3</sub> 受容体拮抗型制吐剤

【単位】 ▼5mg/Cap

【常用量】 5mg/回

【用法】 1日1回 (添付文書参照)

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【その他の報告】 セロトニン、ヒスタミン誘発による痒み治療に無効 (Weisshaar E, et al: Exp Dermatol 13: 298-304, 2004 PMID: 15140020)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【特徴】 5-HT<sub>3</sub> 受容体に対し強い親和性を有し、セロトニンと受容体との結合を競合的に拮抗することにより制吐効果を発現する。シスプラチン及びその他の抗悪性腫瘍剤投与による悪心・嘔吐に対して高い有効率が得られている。

【主な副作用・毒性】 ショック、心ブロック、頭痛、発熱、下痢、便秘、肝機能異常、しゃっくりなど

【安全性に関する情報】 CYP2D6 の EM に比べて PM では、頭痛や便秘の副作用が強く、持続する傾向にある (Kutz K: Ann Oncol 4 Suppl 3:15-8, 1993 PMID: 8363993)

【吸収】  $k_a=0.8097/hr$  (1)

【F】 61% (1) 平均 60% [27~99%] (Kees F, et al: Br J Clin Pharmacol 52: 705-7, 2001 PMID: 11736884)

【 $t_{max}$ ] 3.4hr (1) と他の 5-HT<sub>3</sub> 受容体拮抗薬に比べやや長い (5) 2.6hr (Kees F, et al: Br J Clin Pharmacol 52: 705-7, 2001 PMID: 11736884)

【代謝】 主に CYP2D6 で代謝 (1) 投与後 2hr における血漿中の存在比は 5-OH-抱合体 49%、6-OH 体 25%、未変化体 18%、6-OH-抱合体 8% (1) 代謝物に活性はない (1) OCT1 により肝取り込みされる可能性 (Tzvetkov MV, et al: Pharmacogenomics J 12: 22-9, 2012 PMID: 20921968) CYP2D6 のある遺伝子変異のホモでは EM と比べて AUC が 6.8 倍 (Kim MK, et al: Eur J Clin Pharmacol 59: 111-6, 2003 PMID: 12728290)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 3.8% (Suminaga M, et al: Gan To Kagaku Ryoho 22: 1209-21, 1995 PMID: 7544965) 尿中回収率は 75% で未変化体 11%、6-OH 体 38%、6-OH-抱合体 13%、5-OH-抱合体 10%、5-OH 体 2% 及び 7-OH 体 0.3% [48hr まで] (1) 胆汁排泄されたものの 45% は腸管循環する [ラット] (1)

【CL】 88.5L/hr (1) 1800mL/min [iv] (Kees F, et al: Br J Clin Pharmacol 52: 705-7, 2001 PMID: 11736884)

【 $t_{1/2}$ ] 8.3hr (1) 5.7hr [po] (Kees F, et al: Br J Clin Pharmacol 52: 705-7, 2001 PMID: 11736884)

【蛋白結合率】 約 60% (1)

【Vd】 642.4L/man (1) 678L/man [iv] (Kees F, et al: Br J Clin Pharmacol 52: 705-7, 2001 PMID: 11736884)

【MW】 320.82

【透析性】 低いと思われる (5) 資料なし (1)

【O/W 係数】  $\text{Logp}=-1.41$  [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】 リファンピシン、フェノバルビタール：酵素誘導による代謝促進の可能性あり (1)

【更新日】 20151201

※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。