

◎カイトリル注射液 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 グラニセトロン塩酸塩 (U) granisetron hydrochloride 【分類】 5-HT₃ 受容体拮抗型制吐剤

【単位】 ◎3mg/A [3mL]

【常用量】 1回 40 μg/kg

【用法】 1日1回, 生食 100mL と混和し 30分かけて点滴静注

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (3)

【特徴】 5-HT₃ 受容体の結合を選択的に拮抗阻害することにより制吐効果を発現する。抗悪性腫瘍剤 (シスプラチン等) 投与及び放射線照射に伴う消化器症状 (悪心、嘔吐) に適用。効果は速効性で、24hr 持続し嘔吐が始まってから投与しても制吐効果を発揮する。ドパミン受容体には作用しない。

【主な副作用・毒性】 ショック, アナフィラキシー, 過敏症, 肝機能障害, 頭痛, 下痢, めまい, 口渇, 食欲不振, 感覚異常, 便秘, 腹部不快感, 血圧変化, 発熱, 顔面浮腫, 下腿のけいれん, 顔面紅潮など

【吸収】 100%近く吸収 (11)

【F】 初回通過効果により 34~59%消失 (11) 60%以下 (13) 100% [sc] (Gurpide A, et al: Oncologist 12: 1151-5, 2007 PMID: 17914085)

【Cmax】 40 μg/kg を 5 分間の静注投与で 63.8ng/mL (癌患者), 42.8ng/mL (健常者), 40 μg/kg を 3 分間の静注投与で 64.3ng/mL (健常者 21~42 歳), 57ng/mL (健常 65~81 歳) (U) 1mg を 1日2回, 7日間経口投与した時 6.0ng/mL (13)

【代謝】 肝で N-脱メチル化, 芳香環酸化を受け, その後抱合。動物実験では代謝物にも 5HT₃ 受容体拮抗作用がある (U) 主に肝で消失 (1) 7-水酸化, N-脱メチル化には CYP3A4 が関与 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 11% [iv, 48hr まで] (1) 8~15% (U) 16% (13) 11% (U) 20%以下 (Eur J Clin Pharmacol 46: 159-162,1994) 15% (Wada I, et al: Biol Pharm Bull 24: 432-5, 2001 PMID: 11305610) 代謝物として尿中に 48~49%, 糞便中に 34~38%排泄 (U)

【CL】 856±538mL/min [iv] (1) 11mL/min/kg, 加齢・肝硬変により低下 (13) 血漿 CL は 617~832mL/min で主に腎外 CL (Eur J Clin Pharmacol 46: 159-62,1994) 総クリアランス 6.3mL/kg/min (Br J Cancer 58: 651-3, 1988) 245mL/min (10) 【腎 CL】 59.6±20.3mL/min (1) 【非腎 CL/総 CL】 90% (10)

【t_{1/2}】 健常人に 40 μg/kg を投与で 4~5hr, 癌患者で 9~12hr だが患者間, 同一患者でもばらつきがある (U) 約 3hr (1) 4.1~6.3hr (Eur J Clin Pharmacol 46: 159-62,1994) 8.96hr (Br J Cancer 58: 651-3, 1988) 11hr (10) 3.9 [2.6~6.8] hr (11) 5.3hr, 加齢・肝硬変により延長 (13)

【蛋白結合率】 65% (U,13)

【Vd】 3L/kg (13) 2~3L/kg, 血漿・血球内を自在に分布する (U) 196L/man (1) 186~264L/man (Eur J Clin Pharmacol 46: 159-62, 1994) 2.85L/kg (Br J Cancer 58: 651-3, 1988) 3.3L/kg (10) 234L/man (11)

【MW】 348.87

【透析性】 分布容積が大きいため、透析で効率的には除去されにくいと思われる (5) 資料なし (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象にはならない 【OW 係数】 0.28 (11) 0.23 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】 9.4 (1)

【相互作用】 セロトニン作用薬との併用でセロトニン症候群のおそれ (1)

【主な臨床報告】 透析掻痒症に効果がある可能性 (Layegh P, et al: Indian J Dermatol Venereol Leprol 73: 231-4, 2007 PMID: 17675729) 高度な透析掻痒症に効果があった症例 (Albares MP, et al: Br J Dermatol 148: 376-7, 2003 PubMed PMID: 12588407)

【備考】 症状改善のない場合は、40 μg/kg を追加投与できる

【更新日】 20180416

※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。