

▼ザジテンカプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ケトチフェンフマル酸塩 (U) ketotifen fumarate 【分類】 アレルギー性疾患治療剤

【単位】 ▼1mg/Cap

【常用量】 2mg/日

【用法】 分2 [朝及び就寝前]

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし。ただし透析患者の投与方法に言及した文献なし (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【特徴】 抗アレルギー作用と抗ヒスタミン作用がある。皮膚症状にも有効。ヒスタミン、ロイコトリエンなどのアレルギー性メディエータ遊離抑制だけでなく、血小板活性化因子 (PAF) 誘発気管支収縮を抑制。PAF によって惹起される気道反応性の亢進は本剤の前投与で著しく阻害され、この予防効果は他剤と比較して強力。抗ヒスタミン薬の中で最も中枢移行性が高く、いれん閾値を低下させる恐れがあるため注意。

【主な副作用・毒性】 膀胱炎様症状、肝障害、過敏症、眠気、口渇、倦怠感など。

【安全性に関する情報】 てんかんまたはその既往歴のある患者には禁忌 [抗ヒスタミン薬の中で中枢移行性が最も高い] (1)

【吸収】 90%以上 (11) 60%は吸収され、おそらくもっと高いが初回通過効果を受ける (U) 食事の影響を受けない (U)

【F】 50% (1,10) 初回通過効果を受け、約 50% (U)

【tmax】 2hr (11) 2~4hr (U, Grahnen A, et al: Biopharm Drug Dispos 13: 255-62, 1992 PMID: 1600111)

【代謝】 肝で代謝され、グルクロン酸抱合体と demethyl 化された Norketotifen という 2 種類の代謝物になる。Norketotifen は未変化体と似た活性あり (11) 主代謝産物はグルクロン酸抱合体で脱メチル化体および N-酸化体がわずかに存在 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1% (1) 尿中回収率 60~70% (1) 未変化体と代謝物をあわせた尿中排泄率 30~50% (11) 48hr 以内に尿中に未変化体として 1%未満、代謝物として 60~70%排泄 (U)

【CL】 クリアランスは小児で大きい (U) 1.55L/hr/kg (1) 97.4L/hr [小児] (McFadyen ML, et al: Eur J Clin Pharmacol 52: 383-6, 1997 PMID: 9272408) 【非腎 CL/総 CL】 100% (10)

【t1/2】 α 相 2.9hr β 相 22hr (1) 22hr (10) 21hr (11) α 相 3~5hr, β 相 21hr (U) $ke=0.103/hr$ (1) 7~27hr で、平均 12hr (Grahnen A, et al: Biopharm Drug Dispos 13: 255-62, 1992 PMID: 1600111)

【蛋白結合率】 75% (U,10) 75%以上 (11) 95% (1)

【Vd】 394L/man [小児] (1, McFadyen ML, et al: Eur J Clin Pharmacol 52: 383-6, 1997 PMID: 9272408)

【MW】 425.5 [salt]

【透析性】 透析性は低いと思われる (5) 資料なし (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない

【O/W 係数】 0.7 [1-オクタノール/0.1N 塩酸, pH6.8] (1) (11) 【pKa】 6.05 (1)

【相互作用】 中枢神経抑制剤との併用注意 (1)

【小児における情報】 体格や BSA が CL に影響する因子 (McFadyen ML, et al: Eur J Clin Pharmacol 52: 383-6, 1997 PMID: 9272408)

【更新日】 20161122

※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。