

▼ジギトキシン錠 [内] <販売中止>

【重要度】【TDM】<販売中止> 【一般製剤名】ジギトキシン (U) digitoxin 【分類】ジギタリス強心配糖体制剤

【単位】▼0.025・▼0.1mg/錠

【常用量】0.05～0.1mg/日

【用法】分1

【透析患者への投与方法】50～75%に減量 (4, 10) 【その他の報告】減量の必要なし (3, 6)

【保存期腎不全患者への投与方法】CLCr>10mL/min : 減量の必要なし, CLCr<10mL/min : 50～75%に減量 (10, 12) 【その他の報告】減量の必要なし (3)

【特徴】心収縮力を増加させる陽性変力作用と心拍数を減少させる陰性変時作用があり、後者が頻脈性上室性不整脈の治療に利用される。前者は心不全のポンプ機能を増強し、これにより鬱血や低酸素血症を改善して不整脈の発生や再燃を抑制する。

【主な副作用・毒性】ジギタリス中毒として以下の症状が現れることがある。食思不振、悪心、嘔吐、易疲労感、頭痛、不眠、抑うつ、黄視、不整脈 (房室ブロック、心室性期外収縮、PAT with block) など

【モニターすべき項目】定常状態の血清ジギトキシン濃度 (トラフ値)、ECG、血清K、Ca、Mg、肝機能、腎機能、脈拍数

【吸収】脂溶性が高いため、経口投与後、ほぼ完全に吸収される (U)

【F】90%以上 (10) 90% (14) 95% (15)

【代謝】主に肝 (腎も) ジギトキシンは3つの糖を持つ非極性化合物であり、8%は12-β-水酸化されてジゴキシンになる。その他はジゴキシン同様、ジギトキシゲニンビス-ジギトキサイド→ジギトキシゲニンモノ-ジギトキサイド→ジギトキシゲニン→エビジギトキシゲニン、抱合体になる経路と還元されてジヒドロジギトキシンになる。さらにジギトキシゲニンビス-ジギトキサイド、ジギトキシゲニンモノ-ジギトキサイド、ジギトキシゲニンはそれぞれ水酸化されてジゴキシゲニンビス-ジギトキサイド、ジゴキシゲニンモノジギトキサイド、ジゴキシゲニン0個になる (さらにエビジゴキシゲニンから抱合体になる) ESRD ではジゴキシンへの変換率が上昇する (通常は8～10%変換される) (12)

【排泄】尿中未変化体排泄率30%以下 (10) 20～25% (12) 8% (14) 【CL】3.3mL/min (10) 0.046mL/min/kg 【非腎CL/総CL】70% (10)

【t1/2】134hr (10) 120～216hr (U) 164hr (14) 144～200hr (12) 【透析患者のt1/2】10日 (4) 195hr (8) 242hr (10) 210hr (12)

【蛋白結合率】90%以上 (U) 94% (12)

【Vd】0.5～0.6L/kg (6) 0.45L/kg (10) 0.6L/kg (14) 腎不全で低下 (12)

【MW】765

【透析性】5%以下 (6) 14% (15) 除去率は低いと思われる (5) 【透析CL】1ml/min (8)

【TDMのポイント】有効治療域は10～25ng/mL (SRL 検査案内,2008) ジギトキシンは消化管からの吸収が100%近いが、効果発現や排泄が遅く、作用時間も長いため中毒時には不利となる。しかし投与量が腎機能に影響されにくい利点もある。ネフローゼ症候群では低蛋白血症により、遊離型分率が上昇し、クリアランスが上昇することがある 【O/W係数】70 (11) 670 (1)

【相互作用】ジゴキシンに準じる。リファンピシンとの併用により半減期が45%に短縮し、血中濃度が53%低下 (Niemi M, et al : Clin Pharmacokint 42:819-850,2003)

【効果発現時間】1～4hr

【最大効果発現時間】8～14hr (U) 5～10hr (日病薬誌 33: 36, 1997)

【効果持続時間】約14日

【更新日】20101013

※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。