

## ▼アルタットカプセル [内]・▼静注用 [注]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】ロキサチジン酢酸エステル塩酸塩 (U) Roxatidine Acetate Hydrochloride 【分類】H2 受容体拮抗薬

【単位】▼37.5mg・▼75mg/Cap [徐放カプセル], ▼75mg/A

【常用量】■胃潰瘍, 十二指腸潰瘍, 吻合部潰瘍, 逆流性食道炎: 1回 75mg 1日 2回, または 150mg 1日 1回寝る前

■Zollinger-Ellison 症候群: 1回 75mg 1日 2回

■注射: 1回 75mg 1日 2回 12hr ごと

【用法】内服・注射: 分1~2

■注射: 1A を 20mL に希釈して少なくとも 2 分以上かけて緩徐に注入もしくは輸液に混合して点滴静注

【透析患者への投与方法】週 3 回透析後に 75mg (1) 過量投与により見当識障害、意識障害、痙攣などの精神神経症状や顆粒球減少症が腎不全では発症しやすい (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】腎障害のある患者では血中濃度が持続することがあるので、使用に際しては投与量を減ずるか投与間隔をあける [慎重投与] (1) (「■内服: Ccr>50mL/min : 75mg を 1日 1~2回, Ccr10~50mL/min : 75mg を 1日 1回, Ccr<10mL/min : 75mg を 48hr 毎 (5) ■注射: 内服薬の 3/4 量 (5) 内服 : 60≤Ccr<90 : 75mg 投与間隔 18hr, 30≤Ccr<60 : 75mg 投与間隔 24hr, Ccr30mL/min 未満 : 37.5mg 投与間隔 24hr、または 75mg 投与間隔 48hr (京)

【特徴】ヒスタミンの基本構造をとらずに H2 レセプターに特異的に拮抗し、その作用はシメチジンの約 6 倍

【主な副作用・毒性】ショック, アナフィラキシー, 無顆粒球症, 再生不良性貧血, SJS, TEN, 肝障害, 間質性肺炎, 心ブロック, 精神錯乱, 便秘など

【吸収】腸管から吸収 (1) 食事や制酸剤の影響を受けない (Labs RA: Drugs 35: s82-s89, 1988)

【F】80.7% [イヌ] (1) 尿中回収率から 70%以上 (1)

【tmax】カプセル: 2~3hr (1)

【代謝】肝臓, 小腸, 血清中のエステラーゼにより脱アセチル化 (M-1) され、それが活性体 (1) 尿中代謝物は脱アセチル体, カルボン酸誘導体 (1) 肝硬変患者では減量が必要と思われる (Tsutsumi M, et al: J Gastroenterol Hepatol 16: 910-5, 2001)

【排泄】尿中回収率 70% [そのうち 80%が活性体の脱アセチル体] (1) 活性体 (脱アセチル体) として 67.5% [iv, 24hr まで] (1) 尿中未変化体排泄率 55~60% [po] (Collins JD, Pidgen AW: Drugs 35:S41-S47, 1988)

【CL】30~40L/hr [iv] (1) 全身 CL や腎 CL は Ccr と正相関する (Lameire N, et al: Drugs 35:s48-s52, 1988)

【t1/2】約 4~5hr (1) Ccr 90mL/min 以上 : 3.9hr, Ccr 60~89mL/min : 5.7hr, Ccr 30~59mL/min : 7.7hr, Ccr 30mL/min 未満 : 12.1hr, 透析患者 14.2hr (1) 腎機能正常者は 6hr であるが末期腎不全患者では 18hr まで延長 (Lameire N, et al: Drugs 35:S48-S52, 1988)

【蛋白結合率】6~11% [腎機能障害患者でも同様] (1)

【Vd】140~150L/man (1)

【MW】384.90

【透析性】HD 除去率 33~43% [濃度変化率] (1) 除去されるが除去率は低く, HD 後補充は不要 (Bender W, Brockmeier D: J Clin Gastroenterol 11:S6-S19, 1989)

【TDM のポイント】ペントガストリン刺激試験では 75mg 投与で HCl 84%抑制される (1) 胃酸分泌 50%抑制濃度 [IC50] 64.1±5.8ng/mL (1)

【O/W 係数】29.6 [クロロホルム系pH7] (1) 【pKa】9.3 (1)

【最大効果発現時間】約 30min

【効果持続時間】20~22hr

【備考】小腸における粘着増加を介して, 小腸傷害を抑制する [ラット] (Umegaki E, et al: J Gastroenterol Hepatol 25:S35-S40, 2010)

【更新日】20230418

※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。