

## ◎注射用カタクロット, ▼キサラン注射用 [注]

【重要度】★★ 【一般製剤名】オザグレナトリウム Ozagrel Sodium 【分類】トロンボキサン合成酵素阻害剤

【単位】◎20mg/V

【常用量】■クモ膜下出血術後の脳虚血症状：1日量80mgを24時間かけて持続静注 [2週間]

■脳血栓急性期の運動障害：1回量80mgを2時間かけて朝夕2回点滴静注[約2週間]

【用法】点滴静注

【透析患者への投与方法】明確な減量基準は設定されていないが、腎排泄性であることと易出血性を避けるため1回40mgを1日2回に減量(5) AM透析ならHD日は1日1回HD後、PM透析なら1日2回投与も選択可(5)

【その他の報告】未変化体の尿中排泄率が高く、蓄積する可能性がある。透析のデータはないが健康者の50%量が目安と思われる。蛋白結合率が60~70%であるため透析による除去性にも考慮が必要かもしれない(5) ヘパリンとの併用で出血しやすくなるため注意(1)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 10~50mL/min：1回40~80mgを1日2回、Ccr < 10mL/min：1回40mgを1日2回(5)

【その他の報告】Ccr 50mL/min未満の患者に160mg/日を投与すると、Ccr 50mL/min以上の例に比べて血小板機能の抑制が有意に強く認められるため減量や出血性副作用に対する配慮が必要(三星知, 他: TDM研究 27:199S, 2010)

腎機能低下患者で血小板凝集抑制作用が増強する可能性があるため注意(三星知, 他: 日腎薬誌 3:9-13, 2014)

【特徴】選択的なTXA2合成酵素阻害薬で、TXA2の産生を抑制し同時にPGI2の産生を促進する。アラキドン酸、コラーゲンによるヒト血小板凝集およびセロトニン遊離を抑制することにより血小板凝集抑制作用を有する。脳腫瘍破裂によるクモ膜下出血後の脳血管れん縮の発生にはTXA2産生を阻害することにより、れん縮の予防、軽減が可能になると考えられている。

【主な副作用・毒性】出血性脳梗塞、脳出血、消化管出血、ショック、血小板減少、上室性期外収縮、血圧下降、貧血、肝機能障害、腎機能障害、消化器症状など

【Cmax】80mgを2hrかけて点滴静注終了時の血中濃度は1000ng/mL(1)

【代謝】アシル鎖の還元反応およびβ酸化により代謝される。代謝物M-1とM-2はTXA2合成酵素阻害作用と血小板凝集抑制作用を示すが、その作用はオザグレナトリウムよりも弱い(1) 投与量の2/3 [3hrの持続投与終了後に残存しているもののうち1/3は未変化体として排泄]が主として肝臓でβ酸化あるいは還元反応を受けて代謝されてM-1、M-2が生成し24時間以内に大部分が尿中に排泄される(1)

【排泄】未変化体の尿中排泄率は61.1% [24hrまで]、代謝物M-1は25.6%、M-2は7.7% [24hrまで](1)

【CL】422.7mL/hr/kg(1)

【t1/2】α相0.11hr、β相2.09hr(1)

【蛋白結合率】60~70% [ラット](1)

【Vd】単回1.29L/kg、持続0.6~0.7L/kg(1)

【MW】250.23

【透析性】リバウンドがあり透析性は低い(1) 持続静注でHD中の血中濃度低下は認められなかった(佐藤博明, 他: Ther Res 18: 1075-8, 1997)

【TDMのポイント】TDMの対象にはならない【O/W係数】0.085 [1-オクタノール水系, pH7.3](1) 【pKa】3.86, 6.62(1)

【主な臨床報告】出血性合併症を増加させないがアテローム血栓症またはラクナ梗塞の患者の退院時の機能的転帰は改善させない(Wada T, et al: J Stroke Cerebrovasc Dis 2016 PMID: 27567296)

急性脳卒中へのアスピリンとの併用療法は、アスピリン単独よりも効果的だが、他の薬剤のアスピリンとの組み合わせの方がより効果的(Jin L, et al: J Clin Pharm Ther 2019 PMID: 30225937)

急性虚血性脳卒中中に80mg、160mg/日いずれも効果あり(Zhang J, et al: Neurol Res 2012 PMID: 22643078)

【備考】Ca含有輸液との配合可(Tange M, et al: Chem Pharm Bull 2013 PMID: 23449252)

【更新日】20210311

※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。