

△ジルテック錠 [内]

【重要度】★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】セチリジン塩酸塩 (U) Cetirizine Hydrochloride 【分類】持続性選択 H1 受容体拮抗・アレルギー性疾患治療剤

【単位】▼5mg・△10mg錠

【常用量】10mg/日 [最大 20mg]

【用法】1日1回就寝前

【透析患者への投与方法】Ccr 10mL/min 未満の患者には禁忌 (1)

【その他の報告】消失半減期が2~3倍に延長する (1) 透析前に5mg (週3回) 投与で有効かつ安全に投与できる (Noiri E, et al: Nephron 89: 101-104, 2001) 1回5mgを週3回投与で有効な可能性あり (12) 50%に減量 (3) 5mgを週3回HD後~5mg/日 (17)

【PD】50%に減量 (3) 5mg/日 (12,17)

【CRRT】減量の必要なし (3) データなし (12,17)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 50mL/min以上:10mgを1日1回, Ccr 30~49mL/min:5mgを1日1回, Ccr 10~29mL/min:5mgを2日に1回, Ccr 10mL/min未満:禁忌 (1)

【その他の報告】Ccr 30mL/min以下:5mg/日 (U) Ccr>50mL/min:常用量, Ccr 10~50mL/min:75%に減量, Ccr<10mL/min:50%に減量 (10) 慎重投与 [5mgから開始], 減量の示唆, GFR>50mL/min:100%, GFR 10~50mL/min:50%, GFR 10mL/min未満:25%でそれぞれ24hr毎 (京)

GFR>50mL/min:減量の必要なし, GFR 50mL/min以下:5mg/日 (12)

GFR>10mL/min:減量の必要なし, GFR<10mL/min:50%に減量 (3)

GFR>50mL/min:5~10mg/日, GFR 50mL/min以下:5mg/日 (17)

全身CLはCcr 40mL/min以上の患者では正相関しているが, Ccr 40mL/min未満の患者では相関がみられない (Matzke GR, et al: Ann Allergy 59: 25-30, 1987)

【特徴】選択的ヒスタミンH1受容体拮抗作用をもち、効果発現は速やかで強かつ持続的である。好酸球遊走抑制作用を示し、好酸球活性化の指標であるスーパーオキシド産生を抑制することによりアレルギー性炎症の持続と進展を抑制。また、ロイコトリエン及びプロスタグランジンD2の遊離を抑制する。

【主な副作用・毒性】ショック、アナフィラキシー、痙攣、肝機能異常、黄疸、眠気、倦怠感、頭痛、消化器症状、動悸、血球減少、浮腫、尿蛋白、頭重感、めまい、ふらつき、味覚異常、不整脈、血圧異常、血管浮腫、結膜充血、頻尿、排尿困難、悪夢など

【吸収】消化管から約70%吸収 (1) 腸肝循環の存在が推定 (1) 食事により吸収速度は低下するが吸収率は変化しない (U)

【F】70%以上 (13)

【tmax】約1.4hr (1) 1hr (11) 0.9hr (13) 1hr (U) 【Cmax】10mg単回経口投与時313ng/mL (13)

【代謝】ほとんど代謝されない (U) 代謝物の抗ヒスタミン作用はセチリジンの約1/8 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率約50% (1) 60% (U,11) 63~79% (12) 70.9% (13) 大部分が未変化体のまま尿中排泄 (U) P-gpの基質 (1) 【CL】0.74mL/min/kg (13) 0.75mL/hr/kg (11) 中等度腎障害患者で70%低下する (U) CL/F=87.10±6.17mL/min (1)

【t1/2】約7hr (1) 9.42hr (13) 8hr [6.5~10hr] (U) 7~10hr (12) 2相性に消失し半減期は7.4hr (Wood SG, et al: Ann Allergy 59:31-34, 1987) 【腎不全患者のt1/2】Ccr 31~60mL/min:19.2hr, Ccr 7~30mL/min:20.9hr (1) 【透析患者のt1/2】20hr (U) 19.3hr (1) 20~30hr (12)

【蛋白結合率】約92% (1,11) 98.8% (13) 93% (U,12)

【Vd】0.5±0.07L/kg (1) 33~40L/man (11) 0.58L/kg (13) 0.4~0.6L/kg (12) 0.41~0.47L/kgで腎障害の影響は小さい (Matzke GR, et al: Ann Allergy 59: 25-30, 1987)

【MW】461.82

【透析性】透析開始3時間前に単回投与した時の透析による除去率は約10% (1, Awni WM, et al: Eur J Clin Pharmacol 38:67-69, 1990) 蛋白結合率が高く、除去率は低いと思われる (5)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない 【O/W係数】24 (1,11) 【pKa】2.85, 8.33 (1)

【相互作用】ビルジカイニド併用により両者の血中濃度が上昇 (1)

【効果発現】投与後0.5~1.0hr (U)

【効果持続時間】24hr (U)

【更新日】20221105

※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。