

▼アロキシ静注 [注]

【重要度】★ 【一般製剤名】パロノセトロン塩酸塩 (U) Palonosetron Hydrochloride 【分類】5-HT₃ 受容体拮抗型制吐剤

【単位】▼0.75mg/V [5mL]

【常用量】1回 0.75mg

【用法】30 秒以上かけて緩徐に投与し抗悪性腫瘍剤投与前に投与を終了する [1 週未満での反復投与成績はない]

【透析患者への投与方法】Risk-benefit を考慮する必要があるが減量の必要なし (U)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (U)

【その他の報告】設定されておらず高度腎障害患者で AUC が 1.3 倍に上昇 (1)

【特徴】シスプラチン等の抗悪性腫瘍剤投与に伴う消化器症状 (悪心・嘔吐) の抑制に使用される選択的 5-HT₃ 受容体拮抗型制吐剤。半減期が長く、グラニセトロンに比べ遅発性の悪心・嘔吐に対して優れた効果を有する。

【主な副作用・毒性】便秘、頭痛、血管痛、ショック、アナフィラキシー、めまい、不眠、下痢、口腔感想、肝機能検査値異常、しゃっくり、疲労、倦怠感、発熱など

【代謝】50%が主に CYP2D6 により代謝され、主代謝物として N-オキシド体と 6-S-ヒドロキシ体が生成 [いずれも不活性体] (1,U) CYP2D6 の遺伝的多型は未変変化体の薬物動態に与える影響は小さい (1)

【排泄】尿中回収率 83%で未変化体として 40%、代謝物 M9 と M4 として 50% [144hr まで] (1,U, Stoltz R, et al: Biopharm Drug Dispos 25: 329-37, 2004) 尿中回収物に抱合体は認めない (Stoltz R, et al: Biopharm Drug Dispos 25: 329-37, 2004)

【CL】160mL/hr/kg (1) 日本人では CL が 25%大きくなるが用量調節の必要性はない (U) 【腎 CL】66.5mL/hr/kg (1) 2.58~3.50mL/min/kg (Stoltz R, et al: J Clin Pharmacol 44: 520-31, 2004)

【t_{1/2}】2 相性に消失し約 40hr (1,U) 30.8~36.8hr と他の 5-HT₃ 受容体拮抗剤より長い (Stoltz R, et al: J Clin Pharmacol 44: 520-31, 2004) 43.7~128hr (Eisenberg P, et al: Ann Oncol 15: 330-7, 2004)

【蛋白結合率】62% (1,U)

【Vd】未変化体および代謝物はメラニン含有組織 (眼球・皮膚有色部) への高い親和性がある (1) 5.8~10.9L/kg (U) 6.96~9.85L/kg (Stoltz R, et al: J Clin Pharmacol 44: 520-31, 2004) 8.34L/kg (Stoltz R, et al: Biopharm Drug Dispos 25: 329-37, 2004)

【MW】332.87

【透析性】検討されていない (1) Vd が大きいので効率的には除去されない (U)

【OW 係数】資料なし (1)

【相互作用】デキサメタゾン、メトクロプラミド、アプレピタントとの相互作用は認められない (1)

【備考】光に不安定なので保存時には注意 (1) 半減期が長いので短期間での反復投与は避ける (1) 拮抗薬は知られていない (U)

【更新日】20231129

※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、当院では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。