▼オンダンセト注［注］，▼オンダンセトロン OD フィルム［内］

【重要度】　【一般製剤名】オンダンセトロン塩酸塩（U）　Ondansetron Hydrochloride　【分類】5-HT3 受容体拮抗型制吐剤
【単位】▼2mg・▼4mg/OD フィルム，▼2mg/A［1mL］・▼4mg/A［2mL］，▼4mg/smL シリンジ
【常用量】1 回 4mg［効果不十分な場合には同用量を注射で追加投与］
【用法】■内服：1 日 1 回．chemotherapy の 30 分以上前に服用すべき（Clin Pharmacokinet 29: 95-109,1995）
■注射：1 日 1 回緩徐の静注
【透析患者への投与方法】常用量（3,10）
【保存期 CKD 患者への投与方法】常用量（3,10,12）
【特徴】セロトニン受容体の選択的拮抗剤である。嘔吐惹起作用の強い抗悪性腫瘍剤（シスプラチン等）投与に伴う悪心、嘔吐を強力に抑制する。
【主な副作用・毒性】 ショック，アナフィラキシー，過敏症，肝障害，頭痛，一過性の視覚障害，熱感，吃逆，下痢，便秘など
【安全性に関する情報】透析患者における QT 延長からの突然死リスク上昇（Ismail S, et al: J Am Soc Nephrol 2024 PMID: 38409683）
【吸収】速やかにほぼ完全に吸収される（Clin Pharmacokinet 29: 95-109,1995）
【F】53.3%（1）60%（10）59%（11）56%（U）初回通過効果を受けるため 66%と低いが，肝障害では初回通過効果を受けないため 100%近くになる（J Clin Pharmacol 36: 206-215,1996）食事と同時摂取でわずかに F は上昇，制酸剤の影響はない（Clin Pharmacokinet 29: 95-109,1995）
【tmax】内服：2hr（1）0.5～2hr（Clin Pharmacokinet 29: 95-109,1995）1～1.5hr（11）1hr（13）
【Cmax】0.15mg を単回静注後 102ng/mL、健常者に 8mg を 1 日 3 回経口投与時 39ng/mL（13）
【代謝】主に肝代謝（J Clin Pharmacol 36: 206-15,1996）肝クリアランスが全身クリアランスの 95%を占め代謝物に活性はない．また遺伝的多型性もない（Clin Pharmacokinet 29: 95-109,1995）シクロスポリンにより CYP3A が阻害され、7-および 8-水酸化が 27%減少する（11）CYP3A4，2D6，1A2 で代謝（1）8-水酸化体に活性はない（1）
【排泄】尿中未変化体排泄率 7.6%［iv］（1）2.5～5%［po］（1）10%以下（10,11）5%（12,13）5%未満（U）尿中回収率 40%［24hr まで］で 8-OH 体のグルクロン酸あるいは硫酸抱合体がメイン（1）
【CL】7.5mL/min/kg（Semin Oncol 19: 9-15,1992）417mL/min（10）0.45L/hr/kg（11）5.9mL/min/kg、加齢・肝硬変・女性で低下（13）
【t1/2】4.7～5.7hr（1）3.5hr，加齢・肝硬変で延長（10,13）5.7hr（U）4.8hr（β相）3.8hr（Clin Pharmacokinet 29: 95-109,1995）3hr、75 才で 5.5hr に延長（11）2.5～5.5hr（12）【透析患者の t1/2】5～9hr（10）腎機能正常者と同じ（12）
【蛋白結合率】88%（1）70～76%（U,11）肝障害では低下（J Clin Pharmacol 36: 206-15,1996）73%（13）75%（12）
【Vd】2.3L/kg（10）160L/man（Clin Pharmacokinet 29: 95-109,1995）138～188L/man（11）1.9L/kg（13）2L/kg（12）【分布】全血/血漿濃度比=0.83（13）
【MW】365.86
【透析性】蛋白結合率がやや高く分布容積も大きいため透析で除去されにくいと思われる（5）資料なし（1）
【TDM のポイント】TDM の対象にはならない
【O/W 係数】0.6［1-オクタノール系，pH5.95］（1）【pKa】7.4（1）
【併用注意】CYP3A4 誘導作用を有する薬剤（フェニトイン、カルバマゼピン、リファンピシン等）リファンピシン併用により経口投与時の AUC が 65%低下し，Cmax が 50%低下し，消失半減期が 38%短縮し，bioavailability が 60%から 40%に低下，静注投与時の AUC が 48%低下し，半減期が 46%短縮し，全身クリアランスが 1.83 倍に増大する（Villikka K, et al: Clin Pharmacol Ther 65: 377-81,1999）
【更新日】20240307

※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。