

▼ミケラン錠・▼LAカプセル・▼細粒 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】カルテオロール塩酸塩 (U) carteolol hydrochloride 【分類】β遮断薬

【単位】▼5mg/錠, ▼15mg/LA, ▼1%細粒

【常用量】10～15mg/日 [最大30mg]

【用法】分2～3

【透析患者への投与方法】25%に減量 (3)

【その他の報告】25～50%に減量 (5)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr>50mL/min : 75～100%に減量, Ccr10～50mL/min : 50～75%に減量, Ccr<10mL/min : 25～50%に減量 (5)

【その他の報告】Ccr10～40mL/min : 50%に減量, Ccr 10mL/min 以下 : 25%に減量 (Hasenfuss G, et al: Eur J Clin Pharmacol 29: 461-5,1985)

Ccr10～50mL/min : 50%に減量, Ccr<10mL/min : 25%に減量 (3,10,12)

Ccr 20～60mL/min : 常用量を48hr毎, Ccr 20mL/min 未満 : 常用量を72hr毎 (U)

【特徴】非選択的β遮断薬で、ISAあり、MSAなし。

【主な副作用・毒性】喘息発作, 心不全の増悪, 房室ブロック・洞不全症候群・洞停止等の高度の徐脈性不整脈, うっ血性心不全またはその悪化, 冠攣縮性狭心症, 徐脈, 動悸, 頭痛, 眠気, 霧視, 消化器症状など

【吸収】吸収速度定数1.72/hr, 95%以上が吸収されAUCは食事に影響しない (1)

【F】83.7% (Ishizaki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 25: 95-101,1983) 85% (U)

【tmax】1.5hr (1) LA約5hr (1)

【代謝】一部はCYP2D6により水酸化され、8-ヒドロキシカルテオロールとして排泄される (1) 主要代謝物は8-ヒドロキシカルテオロールとカルテオロールのグルクロン抱合体 (Hasenfuss G, et al: Eur J Clin Pharmacol 29: 461-5,1985) 代謝物の活性は弱い (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率64～76% [24hr] (1) 60～70% (10) 50～70% (U) 63% (Hasenfuss G, et al: Eur J Clin Pharmacol 29: 461-5,1985) 65.0% [iv], 53.8% [po] (Ishizaki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 25: 95-101,1983)

【CL】10.13mL/min/kg (Ishizaki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 25: 95-101,1983) 【腎CL】6.56mL/min/kg、CLCrを超えているため、糸球体濾過だけでなく尿細管分泌されていると考えられる (Ishizaki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 25: 95-101,1983) 255mL/min (Hasenfuss G, et al: Eur J Clin Pharmacol 29: 461-5,1985) 尿細管から能動的に分泌される (Tabei K, et al: Eur J Clin Pharmacol 43: 417-421,1992) 【腎CL/総CL】64.75% (Ishizaki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 25: 95-101,1983) 【非腎CL/総CL】30% (10)

【t1/2】5hr (1) 6hr (U) 4.7hr (Ishizaki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 25: 95-101,1983) 5.4～7hr (10) 3.4～7.2hr (11) 7.1hr (Hasenfuss G, et al: Eur J Clin Pharmacol 29: 461-5,1985) 7hr (12) 【透析患者のt1/2】33hr (10) 腎不全では最長41hrに延長 (Hasenfuss G, et al: Eur J Clin Pharmacol 29: 461-5,1985) 33hr (12) 【ke】0.12/hr (1)

【蛋白結合率】15% (1) 20～30% (12) 23～30% (U)

【Vd】4.05L/kg (Ishizaki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 25: 95-101,1983) 4L/kg (12)

【MW】328.83

【透析性】Vdが大きいため透析で除去されにくい (5)

【OW係数】0.21 (11) 0.21 [1-オクタノール/buffer, pH7] (1) 【pKa】9.74 (1)

【相互作用】交感神経抑制剤, 血糖降下剤, 徐脈性Ca拮抗薬, I群抗不整脈薬, ジゴキシン, NSAIDsとの併用注意 (1) 中樞性α2刺激薬と併用時に、中止する際にはβ遮断剤を先に中止する (1)

【更新日】20151203

※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。