

▼コバシル錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】ペリンドプリルエルブミン (U) perindopril erbumine 【分類】ACE 阻害薬

【単位】▼2mg・▼4mg/錠

【常用量】2~4mg/日 [最大 8mg/日]

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】50%に減量 (12) 【その他の報告】Ccr 30mL/min 未満では活性代謝物の血中濃度が高くなり、過度の降圧が起こるおそれがあるため減量しつつ慎重投与 (1) 25~50%に減量 (3) 2mg を 48hr 毎 [空腹時投与] (17) 【PD】不明 (3) 2mg を 48hr 毎 [空腹時投与] (17) 【CRRT】2mg を 24~48hr 毎 (17)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr > 50mL/min : 減量の必要なし, Ccr 10~50mL/min : 75%に減量, Ccr < 10mL/min : 50%に減量 (12) 【その他の報告】GFR 10~50mL/min : 75%に減量, GFR < 10mL/min : 50%に減量 (3) Scr 3.0mg/dL 以上または CCr 30mL/min 未満では活性代謝物の血中濃度が高くなり、腎機能の悪化や過度の降圧が起こるおそれがあるため減量しつつ慎重投与 (1) GFR > 50mL/min : 4mg を 24hr 毎, GFR 10~50mL/min : 2mg を 24~48hr 毎, GFR 10mL/min 未満 : 2mg を 48hr 毎 [いずれも空腹時] (17)

【特徴】持続性 ACE 阻害薬。SH 基を有さないプロドラッグで、生体内で活性代謝物ジアンチド体のペリンドプリラートに変換される。

【主な副作用・毒性】咳、高カリウム血症、めまい、頭痛、急性腎不全、倦怠感、消化器症状など

【F】94% (1) 65~75% (U) 食事で活性体の AUC が 35%低下 (U) 23%が活性体に変換される (1)

【tmax】活性体ペリンドプリラート : 5~10.7hr (1) 腎障害時においては延長 (1)

【代謝】エステル型プロドラッグで、エチルエステル基が加水分解されて活性代謝物であるペリンドプリラートを生成する (1) 第 2 の代謝経路は分子内脱水反応による環状ラクタム体を生成する経路で、第 3 の経路はグルクロン酸抱合体 (1) 活性体に変換されずに直接グルクロン酸抱合される経路もある (1) 未変化体には活性はない (1)

【排泄】尿中排泄率 : 未変化体 21~26%、ペリンドプリラート 3~10%、ペリンドプリラートのグルクロン酸抱合体 12~14% [po, 24hr まで] (1) 尿中回収率 40~49% (1) 尿中回収率 75%で、未変化体 4~12%、ペリンドプリラート 4.5~22% (U) 【CL】活性体の腎 CL 75mL/min (1)

【t1/2】ペリンドプリラート : 57.3~105hr (1) 79.9 ± 14.0hr (Yamada S, et al : Biol Pharm Bull 26:872-875,2003) 未変化体 1~2hr, 活性体はみかけ 3~10hr であるが γ 相では 30~120hr (U)

【蛋白結合率】ペリンドプリル : 59.9~61.0% (1) 60% (U,12) ペリンドプリラート : 10.2~18.2% (1) 10~20% (U,12)

【Vd】0.16~0.22L/kg (12)

【MW】441.60

【透析性】ペリンドプリラートの透析クリアランスは 66.5mL/分で、透析により除去される (1) 【HD クリアランス】108.1 ± 5.9mL/min (Yamada S, et al : Biol Pharm Bull 26:872-875,2003) ペリンドプリル 52mL/min, ペリンドプリラート 67.2mL/min (U)

【O/W 係数】0.15 [1-オクタノール/buffer, pH7.0] (1)

【相互作用】ARNI とは 36hr 以上あけて切り替え (1)

【更新日】20201217

※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。