

▼インヒベース錠 [内] <製造中止>

【重要度】 【一般製剤名】 シラザプリル水和物 (U) cilazapril hydrate 【分類】 ACE 阻害薬

【単位】 ▼0.25mg・▼0.5mg・▼1mg/錠

【常用量】 0.5mg/日より開始し最大2mg/日

【用法】 分1

【透析患者への投与方法】 投与量を減らすか投与間隔をのばし、少量より開始して慎重投与 (1) 【その他の報告】 毎 HD 後に 0.5mg (Fillastre JP, et al: Br J Clin Pharmacol 27 Suppl 2:275S-282S, 1989)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 Scr 3mg/dL 以上の場合には、投与量を減らすか投与間隔をのばし、少量より開始して慎重投与 (1) 腎障害時には 0.25mg/日から開始 (1)

【特徴】 吸収率の高いプロドラッグ。活性代謝物シラザプリラートに変換され、ACE を阻害する。

【主な副作用・毒性】 咳、めまい、ふらつき、肝機能検査値異常、血管浮腫、急性腎不全、高 K 血症など

【吸収】 80~100%吸収される (1) 食事の影響でやや低下 (U)

【F】 投与量の 80%が活性代謝物に変換 (1) 60% (11) シラザプリラートとして 91% (Williams PE, et al: Br J Clin Pharmacol 27 Suppl 2:181S-188S, 1989) 57% (U)

【tmax】 活性体として 2hr (1)

【代謝】 主に肝臓でエチルエステルが加水分解により脱エチル化され活性代謝物シラザプリラートに変換される (1)

【排泄】 尿中排泄率：未変化体約 20%、シラザプリラート 70~80% [po, 48hr まで] (1) シラザプリラートとして尿中に 90%回収 (11) 【CL】 シラザプリラート 16.0L/hr (1)

【t1/2】 シラザプリル：1~1.5hr (11) 1.5hr (1) シラザプリラート：α相 2hr, β相 50hr (1) α相 1.5~2hr, β相 30~50hr (11)

【蛋白結合率】 シラザプリラート：高濃度では 24%、低濃度では 95%と濃度依存的 (1) シラザプリル 20~30% (11)

【Vd】 25.4L/man (1) シラザプリル 20~30L/man (11)

【MW】 435.51 [シラザプリル] 389.45 [シラザプリラート]

【透析性】 ある程度の透析性がある (1) 低濃度では蛋白結合率が高く除去されにくくなる可能性がある (5) 【HD クリアランス】 シラザプリル 5.05L/hr, シラザプリラート 4.57L/hr (1) 2 L/hr (Fillastre JP, et al: Br J Clin Pharmacol 27 Suppl 2:275S-282S, 1989)

【O/W 係数】 0.65 [1-オクタノール/buffer, pH7.4] (1)

【更新日】 20220406

※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。