

## ▼ カドラル錠 [内] &lt;製造中止&gt;

【重要度】★★ 【一般製剤名】カドアラジン cadralazine 【分類】持続型血管拡張降圧剤

【単位】▼5mg・▼10mg/錠

【常用量】10～20mg/日

【用法】分1

【透析患者への投与方法】主として腎から排泄されるため蓄積が起こる可能性あり、1日5mgでも腎不全患者には多すぎる可能性あり (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 17: 213-220,1992) 【その他の報告】初回5mg, 患者に合わせて2～3週間で5mg増量する。最大10mgまで (1) 未変化体尿中排泄率は高いものの活性本体は代謝物であり活性代謝物の尿中排泄率は低い。ため、大幅な減量は必要ないが、原則少量から開始する (5)

【保存期腎不全患者への投与方法】CLCr>50mL/min以上: 10mg/日、CLCr10～50mL/min: 5～10mg/日、CLCr<10mL/min: 5mg/日 (5)

【特徴】標的部位で活性化。1日1回の優れたコンプライアンスで安定した効果。血圧の日内変動が少ない。投与後4時間で最大の降圧が得られ、16～26時間にわたって持続する。降圧に伴う反射性交感神経亢進作用はヒドララジンと同程度である。心拍出量、腎血流量を増加させる。腎機能、脂質、糖代謝等への影響が少ない。

【主な副作用・毒性】狭心症発作、SLE様症状、劇症肝炎 (類似化合物である塩酸ヒドララジンで報告されている)。動悸、不整脈、頭痛、めまい、ふるえ、下肢神経痛、胃腸障害、Hb・Ht低下、肝障害、眼精疲労、排尿回数減少など

【吸収】速やかに完全 (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 10: 147-153,1985)

【tmax】0.6～0.8hr (代謝物が活性体となるため短い) (1)

【代謝】活性代謝物 (M-II): カルボエトキシ基の離脱により生成。hydrazino-pyridazine 代謝物 CGP22639 は活性を有する (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 17: 213-220,1992)

【排泄】活性本体の代謝物の尿中排泄率は低い (1) 腎; 未変化体尿中排泄率69～73% (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 10: 217-223,1985) 未変化体尿中排泄率73% (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 10: 147-153,1985) 【CL】245～252mL/min (1) 251～295mL/min (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 10: 217-223,1985) 182mL/min (10) 【腎CL】162～173mL/min (1) 185～216mL/min (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 10: 217-223,1985) 【非腎CL/総CL】20% (10)

【t1/2】1.9～2.2hr (1) 1hr (10) 2.5hr (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 10: 217-223,1985) 【透析患者のt1/2】活性代謝物のt1/2は約2倍に延長 (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 17: 213-220,1992)

【蛋白結合率】13.6% (1) 70～80% (10)

【Vd】0.67L/kg (10) Vss: 76～83L/man (1)

【MW】283.33

【透析性】30% (1)

【TDMのポイント】TDMの対象にはならない【OW係数】1.9 (CHC13/pH7) (1) 【pKa】6.2 (1)

【最大効果発現時間】4～6hr (Eur J Drug Metab Pharmacokinet 17: 213-220,1992)

【備考】使用初期に動悸、頭痛、眩暈等の薬理作用に基づく副作用の出現が見られる。これはβ-遮断剤の併用で抑制される。腎排泄型なので腎不全患者に対しては慎重に投与、しかし腎毒性はない。

【更新日】20120128

※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。