

◎ワイテンス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 グアナベンズ酢酸塩 (U) guanabenz acetate 【分類】 高血圧症治療剤

【単位】 ◎2mg/錠

【常用量】 4～8mg/日

【用法】 分2

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3,4,10,12)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10,12)

【その他の報告】 慎重投与 [排泄遅延により高い血中濃度が持続するおそれ] (1)

【特徴】 延髄の血管運動中枢で α_2 受容体を刺激し血管運動中枢を抑制して血圧を低下させる。クロニジンに類似した化合物だが神経伝達遮断作用を有するところが異なる。腎機能に影響を及ぼさないので高齢者にも長期間使用しうる。眠気の副作用があるが寝る前に服用すると早朝の血圧上昇を防ぐことができる。機序は不明であるが糖尿病性の下痢にも有効なことがある。

【主な副作用・毒性】 口渇、眠気、消化器症状、過敏症、めまい、鼻閉、呼吸困難、肝機能障害など

【モニターすべき項目】 血圧

【吸収】 約 75% が消化管から吸収される (U)

【F】 20% (10) 初回通過効果を受けるためかなり低い (U) 97% が初回通過効果を受ける (1)

【tmax】 2～5hr (U) 2hr (1)

【代謝】 肝代謝 (U) 異性化され抱合される経路と、4-水酸化され抱合される経路があり、水酸化経路が優位 (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1%以下 (U) 5%以下 (12,15) 1% (14) 5%以下 (10) 糞便中約 16% (U) 尿中回収率 41% で主として 4-水酸化体およびその抱合体であり、未変化体はわずか (1) 腸管循環する (1)

【t1/2】 平均 6hr (U) 5.4hr (1,2) 12～14hr (4,10,12) 8.5hr (14) 10～14hr (15) 【透析患者の t1/2】 14.2～64.4hr (2)

【蛋白結合率】 90% (U,12) 58～60% (1)

【Vd】 100～200L/kg (6) 105～191L/kg で、用量依存的に変化する (10)

【MW】 291.13

【透析性】 Vd が大きいので透析性は低いと思われる (5)

【TDM のポイント】 10ng/mL 以上 (14) 0.2～25ng/mL (15) 安全性が高いため TDM の対象にはならない

【O/W 係数】 0.52 [クロロホルム/水系, pH7] (1) 【pKa】 8.01 (1)

【相互作用】 セチプラチン・マレイン酸塩、ミアンセリン塩酸塩併用により降圧効果減弱の可能性 (1)

【効果発現時間】 60min 以内 (単回投与) 【最大効果発現時間】 2～4hr

【効果持続時間】 12hr (単回投与)

【備考】 急激に中止すると血圧上昇、神経過敏等のリバウンド現象がみられるので徐々に減量する。β遮断剤と併用していて両者とも中止するときはリバウンド現象を避けるため、β遮断剤を先に中止してから数日間経過をみつつ本剤を徐々に減量し中止する。

【更新日】 20180122

※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。