

△スプレンジール錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】フェロジピン (U) felodipine 【分類】Ca拮抗薬

【単位】▼2.5mg・△5mg/錠

【常用量】5～10mg/日 [最大20mg]

【用法】分2

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (1,3)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (3,10,12)

【特徴】従来のジヒドロピリジン系Ca拮抗剤に比べ、血管平滑筋に対する選択性が高く、心拍出量を増加させる。臨床投与量で心筋を全く抑制しないので心筋収縮力の低下している高血圧に適している。S体にCa拮抗作用としての活性がある (13)

【主な副作用・毒性】血管浮腫、ほてり、頻脈、動悸、浮腫、頭痛、めまい、肝障害、血液凝固障害、貧血、頻尿、パーキンソン様症状、便秘、胃腸障害、歯肉肥厚、発疹、掻痒など

【モニターすべき項目】血圧、ECG、心拍数、肝機能、腎機能

【吸収】100% (11)

【F】20% [完全に吸収されるが初回通過効果を受ける] (U) 16% (10) 15%, 食物との同時摂取で上昇 (13) 84%が初回通過効果を受ける (1)

【tmax】1.0～1.4hr (1) 徐放剤 3.7hr、通常錠剤 0.9hr (13) 徐放剤 2.5～5hr (U) 【Cmax】10mgの通常錠剤を1日2回経口投与したときの定常状態のCmaxは34nM、10mgの徐放錠を1日2回経口投与したときの定常状態のCmaxは9.1nM (13)

【代謝】肝で6種類の代謝物になるが代謝物に血管拡張作用はない (U) 小腸上皮細胞にあるCYP3A4によって約70%が代謝を受け、未変化体として残りの30%が肝臓に到達する。続いて肝CYP3A4によって代謝され最終的にはFが15%となる (13) 代謝物に活性はない (1)

【排泄】尿中に70%回収 (U) 尿中未変化体排泄率0.5%以下 (U) 10%以下 (10) 1%以下 (12,13) 検出されない (1) 胆汁・糞中排泄10% [未変化体0.5%以下] (U)

【CL】823mL/min (1) 1150mL/min (10) 12mL/min/kg、加齢・肝硬変・心不全で低下 (13) 【非腎CL/総CL】100% (10)

【t1/2】α相 1.9～2.7hr (1) β相 11～16hr (U) 11.4hr (10) 平均 25hr (12～36hr) (11) 14hr、加齢・心不全で延長 (13) 10～14hr (12) 【透析患者のt1/2】15～29hr (10) 21～24hr (12)

【蛋白結合率】99%以上 (U,12) 99.6%, 腎障害・肝硬変で低下 (13) 99.3～99.4% [Alb] (1)

【Vd】9.7L/kg (10) 10L/kg、肝硬変で低下 (13) 9～10L/kg (12) 10L/kg (1)

【分布】全血/血漿濃度比は1.45 (13) 中枢への移行率2～4% (1)

【MW】384.25

【透析性】ほとんど除去されない (1) 除去されない (J Clin Pharmacol 31:709, 1991) PD, DHPのデータはない (1)

【TDMのポイント】高血圧患者の拡張期血圧を低下させるEC50は8nM (13) 安全性が高いためTDMの対象にならない【O/W係数】油相に分配 (1)

【相互作用】グレープフルーツジュース飲用で血中濃度が約2～6倍に上昇する (1) Fが低いため相互作用が強く現れやすいと考えられる (5) SJWのCYP3A4誘導作用により血中濃度が低下する可能性 (1)

【効果発現時間】2～5hr

【効果持続時間】24hr

【更新日】20180410

※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。