

## ▼オドリック錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】トランドラプリル (U) trandolapril 【分類】ACE 阻害薬

【単位】◎1mg・▼0.5mg/錠

【常用量】1～2mg/日

【用法】分1

【透析患者への投与方法】尿中から未変化体として排泄されるが減量しなくても顕著な副作用は現れにくい (5)

【その他の報告】50%に減量 (17) 活性代謝物トランドラプリラートが蓄積するため減量すべきだとする報告があるが具体的な至適投与量には言及していない (J Cardiovasc Pharmacol 23: S50-S59, 1994 および Br J Clin Pharmacol 35: 128-135, 1993)

【PD】50%に減量 (17)

【CRRT】減量の必要なし (17)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr 30mL/min 以下または Scr 3mg/dL 以上の重篤な腎障害患者では、活性代謝物の血中濃度が上昇して過度の血圧低下や腎機能を悪化させるおそれがあるため減量するか投与間隔をあけて慎重に投与 (1) 【その他の報告】GFR 10mL/min 未満：50%に減量 (17)

【特徴】活性代謝物トランドラプリラートに変換されるプロドラッグ。低用量においても組織内 ACE を持続的に阻害する。尿中排泄率が低く、胆汁を介した糞中への排泄が多い。透析患者では貧血、高カリウム血症および AN69 膜との相互作用に注意が必要。腎での TGF-β1 発現を抑制する (Shin GT, et al: Am J Kidney Dis 36: 894-902, 2000)

【主な副作用・毒性】腎機能障害の増悪、横紋筋融解症、肝機能障害、黄疸、高 K 血症、血球減少、発疹、空咳、血管浮腫 (呼吸器・腸管)、味覚障害、膝炎など

【モニターすべき項目】血圧測定、白血球数、血清 K 濃度

【吸収】食物と一緒に服用すると吸収が遅延するが、AUC や Cmax には影響しない (U)

【F】10% (U) 活性体 40～60% (11)

【tmax】0.8～1.1hr (1) 活性体 3～7hr (1)

【代謝】エステラーゼにより活性体であるトランドラプリラートに代謝され、さらに非活性体に代謝される (U, 11) トランドラプリラートは脂溶性であり、腎機能障害時でも投与量の調節は不必要 (Danielson B, et al: J Cardiovasc Pharmacol 23: S50-S59, 1994 および Bevan EG, et al: Br J Clin Pharmacol 35: 128-135, 1993) トランドラプリラートはグルクロン酸抱合される (1) 活性体は未変化体の 2200 倍の活性がある (1)

【排泄】尿中回収率は未変化体 0.5%以下、トランドラプリラート 13.8% (11) 尿中排泄率 33% (12) 尿中回収率 33%でトランドラプリラートとして 15% (U) トランドラプリラートとして 10～15%が尿中に排泄 [po, 24hr まで] (1) 尿中回収率 7.3%～22.9% [[po, 24hr まで] (1) 糞中回収率は未変化体 10%、トランドラプリラート 29.4% (11)

【t1/2】■未変化体 2hr (1) 6hr (U) ■トランドラプリラート 6～30hr, γ相 4～7 日 (1) 24hr (10) γ相は 47～98hr で用量依存性 (11) 6～10hr (12) 10hr (U)

【蛋白結合率】未変化体 80% [濃度依存性はない]、トランドラプリラート 60～94% [濃度依存性あり] (U) 94% (10) 65～94% (12) 未変化体 80.1～87.3%、トランドラプリラート 81.7～93.1% (1)

【Vd】17.8L/man (11) 0.26L/kg (12) 未変化体の Vd/F 600～1500L/man (1) 活性体の Vd/F 180L/man (1)

【MW】430.54

【透析性】未変化体、活性体ともわずかしこ除去されない (U) 蛋白結合率が高いため、比較的除去されにくいと思われる (5) わずかに除去される (1)

【TDM のポイント】薬物動態と ACE の阻害の程度や血圧とは関連しないため TDM の対象にはならない (Br J Clin Pharmacol 35: 128-135, 1993) 【薬物動態】トランドラプリルの薬物動態は腎不全によって影響を受けないが、活性代謝物のトランドラプリラートは CLCr が 30mL/min 以下になると排泄が遅延し蓄積する (J Cardiovasc Pharmacol 23: S50-S59, 1994) 【O/W 係数】4.9 [1-オクタノールリン酸 buffer, pH7.0] (1) 【pKa】3.1, 5.7

【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。