

▼キニジン硫酸塩錠 [内]

【重要度】【TDM】 【一般製剤名】キニジン硫酸塩 (U) Quinidine Sulfate 【分類】不整脈治療剤 [クラス Ia]

【単位】▼100mg/錠

【用法】■試験投与:1回100~200mg■維持量:200~600mg分1~3■大量投与:1回400mgを1日5回3日間で効果がない場合には中止する■漸増法:1回200mgを1日3回で効果がない場合は1回量を400mg, 600mgと増やすか投与回数を1日4回, 5回, 6回と増やす

【透析患者への投与方法】尿中排泄率は15~40%あるが、腎不全でも総クリアランスは変化しない (11) ため顕著な減量は必要ないと思われる (5) 【その他の報告】投与間隔を3倍に延長 (12) 減量の必要なし (3) 100mgを4hr毎 [75%に減量, HD日はHD後] (17) 【PD】75%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】減量の必要なし (3,10) 【その他の報告】GFR 50mL/min未満:投与間隔を2~3倍に延長 (12) GFR 10mL/min以上:減量の必要なし, GFR 10mL/min未満:75%に減量 (17)

【特徴】歴史の古い抗不整脈薬で、最少有効量と中毒量の間が狭く、中毒・副作用について細心の注意が必要であること、さらに頻脈型の不整脈に用いる場合、投与総量を増やしていくと治療効果が先に出てくるのか副作用が先に出てくるのか予測しにくい。不応期を延長し、刺激伝導速度を遅くし、心房筋の自動能を抑える方向に働く。一方、副交感神経の作用を抑える働きもあるので、臨時的にはキニジン固有の効果と逆の結果になって現れるものがある。交感神経 α 受容体遮断作用と陰性変力作用がある。

【主な副作用・毒性】高度伝導障害, 心停止, 心房細動, QRS幅の増大, 期外収縮発生数の増加, 心室頻拍, P波の消失, 心不全, 血圧降下, SLE様症状, 白血球減少, 再生不良性貧血, 溶血性貧血, 血小板減少性紫斑病など

【吸収】95%以上, 食事摂取により吸収が遅れる (11)

【F】70~80% (11,15) 70%かそれ以上 (U)

【tmax】1~1.5hr (11)

【代謝】3-OH体, 2'-oxo体は未変化体と同等の抗不整脈作用を持つが、胆汁排泄されるO-脱メチル体のお活性がほとんどない。未変化体とdihydroxy体は2D6阻害作用がある (11) CYP3A4, 2D6で代謝 (1) CYP3A4で代謝される (U) 3-水酸化体には未変化体の1/2の活性があり, 未変化体の血清濃度を上回ることがあり, Vdも大きい (U)

【排泄】尿中未変化体排泄率10~50% (1) 5~20% (12) 18% (15) 15~40% (11) 塩基性薬物であるため尿pHが6~7から7~8に上昇すると腎CLは1/2になる。腸肝循環はしない (11)

【CL】3~6.5mL/min/kg (15) 高齢者や肝疾患でCLは低下するが腎不全では変化しない (11)

【t1/2】5~12hr (11) 6.2hr (15) 3~20hr (12) 平均6hr, 4~17hrの範囲 (U) 【腎不全患者のt1/2】腎機能正常者と同じ (12)

【蛋白結合率】70~95%, 3-OH体74%, 2'-oxo体46% (11) 70~85% (15) 手術後上昇, 肝障害・肝硬変で低下するが腎不全・高リポ蛋白血症・高齢者では変化なし (11) 70% (12) 70~90% [AAG, Alb] (U)

【Vd】2~3L/kg (11) 2.7L/kg (15) 0.7~3.7L/kg (12) 3L/kg (U) 3-水酸化体のVdは未変化体より大きい (U) 【分布】脳を除き速やかにほとんどの臓器に分布する (11)

【MW】782.94 (遊離塩基324.4)

【透析性】除去率1% (15) 透析では顕著に除去されない (11)

【TDMのポイント】有効血中濃度域3~6 μ g/mL (15) 2~6 μ g/mL (17) 心筋内の濃度は血中濃度の20倍以上になることがある。8または10 μ g/mLで中毒症状を発現するとの報告あり (1) 心不全ではVd低下により血漿濃度が上昇する (11) トラフ基準値2.0~6.0 μ g/mL (SRL検査案内)

【相互作用】併用禁忌多数あり, 添付文書参照 (1) CYP2D6, P-gpを阻害する (1) CYP2D6を阻害する (U)

【効果発現時間】1~3hr (心臓に対する最大効果) (1)

【効果持続時間】6~8hr以上 (1)

【更新日】20230415

※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。