

◎カルデナリン OD 錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ドキサゾシンメシル酸塩 (U) doxazosin mesilate 【分類】 血圧降下剤 [α1遮断薬]

【単位】 ◎1mg・◎2mg・▼0.5mg・▼4mg/OD錠

【常用量】 0.5mg/日から開始, 1~2週間の間隔を置いて1~4mg/日 [高血圧には最大8mg/日, 褐色細胞腫による高血圧症には最大16mg/日]

【用法】 1日1回

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10)

【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】 CKD患者でのα遮断薬の選択は腎イベントリスクを増加させたが, 心イベントリスクは低下させた (Hundemer GL, et al: Am J Kidney Dis 2021 PMID: 32920153)

【特徴】 プラゾシンよりα1受容体選択性が高く, 半減期が長い. 拡張期の血圧を下げやすい. 代謝面への影響が少なく, 脂質代謝, インスリン感受性を改善し, 血糖値に悪影響を及ぼさない. α1選択性はプラゾシンの6倍. 至適量の個人差は比較的大きく, 低用量から開始して血圧に応じて増量する.

【主な副作用・毒性】 意識喪失 (起立性低血圧による), 失神, 不整脈, 脳血管障害, 狭心症, 心筋梗塞, 血球減少, めまい, 頭痛, しびれ感, 耳鳴, 動悸, 肝障害, 頻尿, 尿失禁, 過敏症, 浮腫など

【モニターすべき項目】 血圧

【吸収】 65%, 消化管からの吸収は良好 (U)

【F】 65%, 初回通過効果は受けない (11) 64.5±13.9% (1)

【tmax】 1.5~3.6hr (U)

【代謝】 肝のみで数種の活性・非活性代謝物に代謝される (U) 主にデスメチル体, 水酸化体に代謝 (1) 6-水酸化体には活性があるが, 存在率は低い (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率1%以下 (1) 5%以下 (10,12) 糞便中に未変化体として5%, 代謝物として65%排泄 (U)

【CL】 122mL/min (10) 8.57L/hr [po] (1) 【非腎CL/総CL】 100% (10)

【t1/2】 平均11hr [9~12hr] (11) 9.5~12.5hr (10) 16~22hr (12) 19~22hr, 年齢や軽度の腎障害変化しない (U)

【透析患者のt1/2】 13hr (10) 16~22hr (12)

【蛋白結合率】 98~99% (U) 98%以上 (1,10) 98% (12)

【Vd】 1.4L/kg (10) 1~2L/kg (11) 1.0~1.7L/kg (12) 1.2L/kg [po] (1)

【MW】 547.59

【透析性】 除去されない (1,U)

【TDMのポイント】 TDMの対象にはならない 【O/W係数】 100以上 [クロロホルム系/水系, pH7] (1) 【pKa】 6.9 (1)

【相互作用】 PDE-5阻害剤併用で降圧作用が増強, 低血圧の誘発 (1)

【効果発現時間】 1~2hr (わずかな血圧低下は1hr以内に生じるが, 本格的な降圧は2hr以後に現れる) 【最大効果発現時間】 5~6hr (単回投与)

【効果持続時間】 24hr (単回投与)

【備考】 投与初期にめまい, 立ちくらみ, 動悸, 頭痛等が現れることがある. その際は仰臥位をとらせる等適切な処置を取る. 高齢者には低用量で開始すると共に, 過度の降圧に注意しながら投与する. OD錠はわずかなミント味

【更新日】 20210419

※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.