

▼アプレゾリン錠 ▼散 [内]・▼注射用 [注]

【重要度】★ 【一般製剤名】ヒドララジン塩酸塩 (U) hydralazine hydrochloride 【分類】血圧降下剤

【単位】▼10mg・▼25mg・▼50mg/錠 ▼10%散 ▼20mg/A

【常用量】■内服：初期量 30～40mg/日、血圧により維持量 30～200mg/日 ■注射：1回 20mg

【用法】■内服：分3～4 ■注射：筋注または静注 [1mLの生食または注射用水に溶解]

【透析患者への投与方法】慎重投与 (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【その他の報告】Ccr 10mL/min 以上：常用量、Ccr < 10mL/min：投与間隔を 1～1.5 倍に延長 (10) Ccr < 10mL/min：投与間隔を 1～2 倍に延長 (12)

Ccr > 50mL/min：25～50mg を 8hr おき、Ccr 10～50mL/min：25～50mg を 8hr おき、Ccr < 10mL/min：25～50mg を 12hr おき (3)

腎不全時に毒性が増強する証拠はないが、腎障害患者で血中濃度が上昇する報告があるため高度腎障害患者には慎重投与 (U)

【特徴】降圧作用機序については十分に解明されていないが、動脈血管平滑筋に直接作用して血管拡張作用を示すと考えられている。

【主な副作用・毒性】SLE 様症状、うつ血性心不全、狭心症発作誘発、麻痺性イレウス、呼吸困難、急性腎不全、溶血性貧血、汎血球減少、多発性神経炎、肝障害、消化器症状など

【モニターすべき項目】ANA (ループス様症状)、CBC (U)

【吸収】90%吸収され、その後初回通過効果を受ける (U) 100%吸収され、初回通過効果により 65～90%代謝される (11) 食事の影響を受けない (Walden RJ, et al: Eur J Clin Pharmacol 20: 53-8, 1981 PMID: 7308273) 食事により上昇 (Melander A, et al: Clin Pharmacol Ther 22: 104-7, 1977 PMID: 872490)

【F】初回通過効果を受けるため 26～55% (Talseth T: Eur J Clin Pharmacol 10: 395-401, 1976 PMID: 1001354) アセチル化能の EM10% (U) 10～16% (11) PM31% (U) 30～35% (11) 食事により F は上昇 (11)

【tmax】1～2hr (1,U) 0.5～2hr (11) 20～90min [im] (11)

【代謝】N-アセチル化され、代謝物 MTP になる (Talseth T: Eur J Clin Pharmacol 10: 395-401, 1976) アセチル化能が生体内利用率に影響を及ぼす (1) 血中濃度の個人差はアセチル化能による (Ludden TM, et al: Arthritis Rheum 24: 987-93, 1981 PMID: 7284051)

【排泄】尿中未変化体排泄率 11.1～14.1%、MTP の尿中排泄率は 1.4～2.3% (Talseth T: Eur J Clin Pharmacol 10: 395-401, 1976) 大部分代謝物として尿中に 52～90%、糞便中に 10% (U) 尿中回収率 50～80% [iv] (1) 大部分代謝物として尿中に 65%、糞便中に 10% (11)

【t1/2】2.3hr (1) みかけ：3～7hr、特異的アッセイ：1.5hr (U) 3.7hr (11) 4～6hr (Shepherd AM, et al: Clin Pharmacol Ther 28: 804-11, 1980 PMID: 7438695)

【蛋白結合率】70～85% (1) 87% (U, 11) アルブミンと結合 (11)

【Vd】3.56L/kg (11) 【分布】腎臓中濃度は血漿濃度の 2 倍高いが特に大きな貯蔵部位はない (1)

【MW】196.64

【透析性】透析されにくいと思われる (5)

【pKa】0.5、7.3 (11) 【O/W 係数】低い (11)

【効果発現時間】経口剤：20～45min (1) 静注：5～20% (11) 筋注：10～30min (11)

【効果持続時間】経口剤：7.5hr (1) 6～8hr (11) 注射：2～6hr (11)

【更新日】20200521

※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。