

◎パピペリン塩酸塩注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 パピペリン塩酸塩 (U) papaverine hydrochloride 【分類】 血管拡張・鎮痙剤

【単位】 ◎40mg/A [1mL]

【常用量】 1回 30～50mg, 1日 100～200mg

【用法】 皮下注射. 筋注も可

【透析患者への投与方法】 透析患者の投与方法に言及した文献なし (5) 血管手術において血管に散布する局所投与方法が用いられる (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 透析患者の投与方法に言及した文献なし (5)

【特徴】 各種平滑筋に直接作用して平滑筋の異常、緊張及び痙攣を抑制し、血管を拡張する。またモルヒネなどのアヘンアルカロイドと異なり中枢神経にはほとんど作用を及ぼさない。

【主な副作用・毒性】 呼吸抑制, アレルギー性肝障害, 心悸亢進, 血圧上昇, めまい, 眠気, 脱力感, 頭痛など

【モニターすべき項目】 肝機能試験, 眼圧

【F】 53% [po] (14) 平均 28%であるが個人差があり 5～99% [po] (Berg G, et al: Pharmacol Toxicol 62: 308-10, 1988 PMID: 3413033)

【tmax】 1hr (11)

【代謝】 肝代謝される (U) 肝で 90%が 4'-または 6-水酸化の過程を通り、グルクロン酸抱合体・スルホン酸抱合体に代謝 (11) 肝臓においてはほぼ完全に代謝され、フェノール性代謝物及びそのグルクロン酸抱合体になる (1)

【排泄】 尿中に代謝物として回収 (U) 腎排泄され、代謝物 50～80%, 未変化体 1%以下 (11) いくらかは胆汁排泄される (11) 尿中未変化体排泄率 1% (14) 尿中に未変化体はほとんど排泄されず、フェノール性代謝物のグルクロン酸抱合体として 64%が回収 [po, 48hr まで] (1) 尿中に代謝物として 50%が回収され主に 6-脱メチル体 (Belpaire FM, et al: Xenobiotica 8: 297-300, 1978 PMID: 664752)

【CL】 833mL/min (10) 肝クリアランス 60mL/min (11) 836mL/min [iv] (1, Berg G, et al: Pharmacol Toxicol 62: 308-10, 1988 PMID: 3413033)

【t1/2】 1.6hr (10,14) 0.5～2hr [変化しやすく, 24hr ほど長くなるかもしれない] (U) 1.5～2.2hr (11, Int J Clin Pharmacol Biopharm 15: 227-8,1977 PMID: 873666) 1.75hr (1) 1.2～6.6hr (Berg G, et al: Pharmacol Toxicol 62: 308-10, 1988 PMID: 3413033)

【蛋白結合率】 約 90% (1,U,6,11)

【Vd】 3.1L/kg [iv] (1, Berg G, et al: Pharmacol Toxicol 62: 308-10, 1988 PMID: 3413033) 0.15L/kg (Int J Clin Pharmacol Biopharm 15: 227-8,1977 PMID: 873666) 0.99～1.52L/kg (11) 0.2L/kg (14)

【MW】 375.85

【透析性】 HD によって除去される (U) 除去率は低いと思われるが、半減期が短いので HD の寄与はほぼ無視できると思われる (5)

【TDM のポイント】 有効治療域 0.1～0.2 μ g/mL (14) TDM の対象にならない 【O/W 係数】 低い (11) 【pKa】 6.4 (1)

【相互作用】 機序不明であるが、レボドパの作用を減弱し、パーキンソン症状を悪化させることがある (1)

【更新日】 20200130

※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。