

## ▼プレビブロック注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 エスマロール塩酸塩 (U) esmolol hydrochloride 【分類】 短時間作用型β1遮断剤

【単位】 ▼100mg/10mL/V

【常用量】 1mg/kg を30秒間で心電図の連続監視下に静注、持続投与時には0.15mg/kg/min の速度で開始し心拍数により調節する

【用法】 再投時、少なくとも5分間の投与間隔を置く

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし [慎重投与] (1,12)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし [慎重投与] (1)

【特徴】 β1受容体に対して競合的に拮抗する心臓選択性の高い、短時間作用型のβ遮断薬。メトプロロールよりも心臓選択性が高い。エステラーゼにより加水分解されるため血中からの消失が速やかであり、手術時の上室性頻脈性不整脈に対する緊急処置に適用される。

【主な副作用・毒性】 血圧低下 (0~50%の頻度で発汗を伴う)、心不全、末梢性虚血、房室ブロック、心停止、徐脈、気管支痙攣、呼吸困難、喘鳴、痙攣発作、血栓性静脈炎、肺水腫など。

【tmax】 1.50±0.58min (1)

【代謝】 血球中エステラーゼにより速やかに代謝、CYP2D6 が関与 (1) 赤血球中のエステラーゼにより不活性代謝物に変換 (U) 代謝物に活性はないと思われる (Volz-Zang C, et al: Eur J Clin Pharmacol 46:399-404,1994)

【排泄】 尿中未変化体排泄率1%以下 (1) 10%未満 (12) はほぼ代謝物として腎排泄 (U) 【CL】 243.4±61.1mL/min/kg (1) 285mL/min/kg と大きく、エステラーゼにより代謝されるので、クリアランスは腎機能や肝機能とは関連を認めない (Wiest D: Clin Pharmacokinetics 28:190-202, 1995)

【t1/2】 3.58±1.03min (1) α相: 2分, β相: 9分, 代謝物: 3.7hr (U) 7~15min (12) 不活性代謝物 3.7hr (U) 【腎不全患者の t1/2】 代謝物の半減期が10倍以上に延長する (U,12) 7min (12)

【蛋白結合率】 34~42% (1) 55% (U,11,12)

【Vd】 1.3±0.7L/kg (1) 1.9L/kg (12) 3.4L/kg (11)

【MW】 331.83

【透析性】 代謝物として20%が除去される (Flaherty JF, et al: Clin Pharmacol Ther 45:321-327, 1989) 資料なし (1) 消失が速いためHD除去の寄与は小さいと思われる (5)

【O/W 係数】 4.2 [1-オクタノール/buffer, pH 7.8] (1) 0.42 [1-オクタノール系] (11)

【効果持続時間】 投与中止後10~20min で薬効が消失 (U)

【備考】 ISA (+) MSA (+)

【更新日】 20150825

※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。