

▼ミニプレス錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 プラゾシン塩酸塩 (U) prazosin hydrochloride 【分類】 α ブロッカー血圧降下剤・排尿障害治療剤

【単位】 Δ 0.5mg・▼1mg・▼2mg/錠

【常用量】 ■高血圧：1~1.5mg/日より開始、効果が不十分な場合は1~2週間の間隔で6mg/日まで漸増 [最大15mg/日]

■前立腺肥大症に伴う排尿障害：1~1.5mg/日より開始、効果が不十分な場合は1~2週間の間隔を置いて6mgまで漸増

【用法】 分2~3

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10,12)

【その他の報告】 他の α 遮断薬と同様に少量から開始して起立性低血圧に注意 (5)

【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】 腎機能障害時もPKは変化しないが、腎不全になると遊離型分率の増加と半減期の延長がみられる (Jaillon P: Clin Pharmacokinet 5: 365-76, 1980 PMID: 6994981)

腎不全患者ではAUCが約2倍に増大するので反復投与時には減量を考慮 (Chaignon M, et al: Arch Mal Coeur Vaiss 74: 71-7, 1981 PMID: 6794530 [abstract])

腎障害患者ではPKに変化はないが、血圧降下作用は増強するので注意 (Lameire N and Gordts J: Eur J Clin Pharmacol 31: 333-7, 1986 PMID: 3792430)

【特徴】 交感神経の α 1受容体を選択的に遮断することによって血圧を下降させる。尿道平滑筋、前立腺および前立腺被膜に豊富に存在する α 1受容体を遮断することにより前立腺肥大に伴う排尿障害にも有効。コレステロール代謝に悪影響を及ぼさない利点がある。起立性低血圧を生じやすい。

【主な副作用・毒性】 意識喪失 (起立性低血圧による)、失神、狭心症、徐脈、めまい、頭痛、抑うつ、幻覚、神経過敏、膝炎、女性化乳房、扁平苔癬、血管炎、呼吸困難、鼻出血など

【モニターすべき項目】 血圧

【吸収】 $k_a=3.731/hr$ (1)

【F】 56.9% [43.5~69.3%] (1, Bateman DN, et al: Eur J Clin Pharmacol 16: 177-81, 1979 PMID: 499317) 50~85% (U)

【 t_{max}] 1.2hr (1) 1~3hr (U)

【代謝】 6-O-demethylprazosin, 7-O-demethylprazosin, および抱合体が尿中に認められ、血中には代謝物は認められない (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率2.4% [po] (1) 6% (Jaillon P: Clin Pharmacokinet 5: 365-76, 1980 PMID: 6994981) Fで補正しても5%程度 (5) 5%未満 (12) 尿中回収物は主に脱メチル体の抱合体 (1) 主に胆汁排泄され、尿中には6~10%排泄される (U) 尿中の未変化体はごくわずかである (U)

【CL】 $12.7 \pm 1.3L/hr$ [iv] (Jaillon P: Clin Pharmacokinet 5: 365-76, 1980 PMID: 6994981) CL/F 26.2L/hr (1)

【 $t_{1/2}$] 2hr (1) 2~3hr (12,U) 2.3hr (Hobbs DC, et al: J Clin Pharmacol 18: 402-6, 1978 PMID: 690251) 腎不全患者で3.6hr (12)

【蛋白結合率】 97% (1,12,U, Hobbs DC, et al: J Clin Pharmacol 18: 402-6, 1978 PMID: 690251) 92~97% [Alb, AAG] (Jaillon P: Clin Pharmacokinet 5: 365-76, 1980 PMID: 6994981)

【Vd】 75~97L/man (1) 1.2~1.5L/kg (12) 42.2 \pm 8.9L/man [iv] (Jaillon P: Clin Pharmacokinet 5: 365-76, 1980 PMID: 6994981)

【MW】 419.87

【透析性】 除去されない (1,U)

【TDMのポイント】 TDMの対象にならない 【O/W係数】 0.09 [1-オクタノール水系] (1) 【pKa】 6.2

【備考】

【更新日】 20180903

※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。