

◎シグマート錠 [内], ◎シグマート注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】ニコランジル nicorandil 【分類】 [内] 狭心症治療剤、[注] 不安定狭心症治療剤・急性心不全治療剤

【単位】 ◎5mg/錠, ◎12mg/V

【常用量】 ■内服:15mg/日 ■不安定狭心症:2mg/hr から開始し, 最大 6mg/hr ■急性心不全:0.2mg/kg を 5 分かけて静注し, 0.2mg/kg/hr で持続静注[0.05~0.2mg/kg/hr の範囲で調節]

【用法】 ■内服:1日3回 ■注射:点滴静注 [生食または5%ブドウ糖で希釈]

【透析患者への投与方法】腎機能の低下によっても総クリアランスは変化しないため、減量の必要はないと思われる (Eur J Clin Pharmacol 42: 203-7,1992) 【その他の報告】15mg/日投与でも蓄積性は認められない (臨床透析 14: 1011-4,1998)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】冠拡張作用を持ち、常用量では心拍数や心収縮に変化をもたらさないので低血圧、徐脈症例、高齢者にも用いられる。K channel opener であり、K<sup>+</sup>の流出を促進することによって血管拡張し、静脈に作用せずに、細小動脈を拡張させる。

【主な副作用・毒性】肝機能障害、黄疸、血小板減少、発疹、頭痛、紅潮、動悸、めまい、消化管潰瘍、角膜炎、皮膚潰瘍、血中カリウム増加など。

【安全性に関する情報】難治性舌潰瘍の原因となる (日本口腔外科学会雑誌 54: 291-4, 2008)

【F】75.0±23.6% (1) 75%以上 (10) 75~100% (11)

【tmax】0.55hr (1)

【代謝】ほとんどは脱ニトロ化されてN-(2-ヒドロキシエチル)ニコチンアミドに代謝される (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率0.7~1.2% (1) 0.4% (Eur J Clin Pharmacol 42: 203-7,1992) 尿中に代謝物N-(2-ヒドロキシエチル)ニコチンアミドとして6.8~17.3% 回収 (1) 【CL】2100mL/min (1) 867~1150mL/min (10) 【非腎CL/総CL】100% (10)

【t1/2】α相0.14hr、β相1.5hr (1) 0.75hr (10) 1.0 [0.7~1.2] hr (11) 54.5min (カレントファーマシー 11: 586-9,1993) 【透析患者のt1/2】4.65hr (カレントファーマシー 5: 1439-42,1987) 非透析時102.4min, 透析時49.9min (カレントファーマシー 11: 586-9,1993)

【蛋白結合率】34.2~41.5% (1) 24% (10) 25% (11)

【Vd】19.6L/man [iv] (1) 1.2L/kg (10) 1.0L/kg 以下 (11) 48L/man (1)

【MW】211.17

【透析性】ニコランジル含有牛血清による in vitro HD では7種類の膜すべてで吸着され、透過性も高い (医学と薬学 41: 1137-41,1999) という報告があるが牛血清量は500mLと少なく経時的なクリアランス試験も行っていないため、この報告をもって透析の除去率が高いとはいえず、難しいと思われるが、ある程度透析される特性を有している (5)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない。抗狭心症効果と血中濃度は相関しない (1) 【O/W係数】4.5 [pH5~9] (11) 1.94 [クロロホルム/水系, pH7] (1) 【pKa】3.24 (1)

【相互作用】PDE5 阻害剤, sGC 刺激剤との併用により過降圧を生じるため併用禁忌 (1) リファンピシンの相互作用は認められない (Frydman A: J Cardiovasc Pharmacol 20: S34-S44,1992)

【備考】製剤は湿気の影響を受けやすい (1)

【更新日】20160114

※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。