

△セレクトール錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】セリプロロール塩酸塩 celiprolol hydrochloride 【分類】血管拡張性β1遮断剤

【単位】△100mg・▼200mg/錠

【常用量】100～400mg/日■高齢者では少量から開始する

【用法】分1

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (Eur J Clin Pharmacokinet 39: 573-6,1990, Schmidt P, et al: Wien Klin Wochenschr 97: 729-32,1985)

【その他の報告】半量を24hrおき (10) 75%に減量 (3)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし (Eur J Clin Pharmacokinet 39: 573-6,1990, Schmidt P, et al: Wien Klin Wochenschr 97: 729-32, 1985)

【その他の報告】Ccr<10mL/min : 50%に減量 (10) GFR<10mL/min : 75%に減量 (3)

【特徴】β1選択性でISA作用 (+)。親水性が高いため親油性の高いβ遮断薬に比し、代謝による不活性化を受けにくく、中枢神経系への移行も少ない。β1選択性はアテノロールと同程度で血管拡張作用がある。

【主な副作用・毒性】心不全、心ブロック、動悸、胸痛、血圧低下、徐脈、めまい、喘息発作、しびれ、ふるえ、皮膚症状、涙液分泌減少、霧視、腎機能異常、肝機能異常、浮腫、関節痛、筋肉痛など

【吸収】健常者、腎不全ともに良好 (Wien Klin Wochenschr 97: 729-32,1985)

【F】30～70% (11)

【tmax】4.5hr (10)

【代謝】代謝を受けにくい、尿中には脱エチル体およびそのグルクロン酸抱合体がわずかに認められる (1) モノ脱エチル体にはCYP2D6および3A4が関与 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率20% (10) 10% (12) 18.2% (Wien Klin Wochenschr 97: 729-32, 1985)

【t1/2】3～5hr (10) 4～5hr (12) 【透析患者のt1/2】5～8hr (10) 5hr (12)

【蛋白結合率】25% (10,11) 20～27% (1)

【Vd】データなし (1) 【分布】脳内移行性は低い (1)

【MW】415.96

【透析性】データなし (1) 水溶性薬物であり、蛋白結合率も高くないためある程度は透析されると思われる (5)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない

【OW係数】0.8 (11) 0.16 [1-オクタノール水系, pH6.8] (1) 【pKa】9.6 (1)

【相互作用】イトラコナゾールによりAUCが80%増大し、GFJによりAUCが5%に低下する [吸収過程の相互作用と思われる] (Lilja JJ, et al: Clin Pharmacol Ther 73: 192-8, 2003) 低血糖のマスク (1) 陰性変力・変時作用を有する薬剤とは併用注意 (1) オレンジジュースでFが低下 [機序不明] (Lilja JJ, et al: Clin Pharmacol Ther 75: 184-90, 2004)

【備考】休薬を要する場合は徐々に減量する (1)

【更新日】20161226

※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。