

◎アスペノンカプセル [内]

【重要度】【TDM】 【一般製剤名】 アプリンジン塩酸塩 Aprindine Hydrochloride 【分類】 不整脈治療剤 [クラス Ib]

【単位】 ◎10mg・▼20mg/Cap

【常用量】 ■内服：40～60mg/日 ■注射：1.5～2.0mg/kg [最大1回100mg]

【用法】 ■内服：1日2～3回 ■注射：5%ブドウ糖等で10倍に希釈して静注

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【その他の報告】 1年間の投与でも安全であった (Takata Y, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 35: 553-6, 1997 PMID: 9455712)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【特徴】 クラス Ib 群に属し、適応は主として心室性不整脈に用いられるが、上室性不整脈にも用いられ、心房細動・粗動における心室レートを下げるためにも用いられる。Ia の特徴も有する。

【主な副作用・毒性】 痙攣、肝障害、催不整脈、心室頻拍 (torsades de pointes)、PQ・QRS・QT 延長、徐脈、振戦、めまい・幻覚等の神経症状の出現など

【安全性に関する情報】 経口剤で発汗があらわれたとの報告 (1)

【F】 40% (1) 100% (15) 添付文書の注射剤と経口剤の AUC 比は 50mg 投与時は約 50% であるが、100mg 投与時は 100% に近くなる (5)

【tmax】 2～4hr (1)

【代謝】 CYP2D6 により代謝 (1) 非線形薬物動態を示すため増量により血中濃度の著明な上昇を示すことがある (Yokota M, et al: Arzneimittelforschung 37:184-8,1987) CYP3A4 も関与している (1) 主代謝物はアプリンジンのデスエチル体、水酸化体で水酸化体は抱合体として腎から排泄 (1) デスエチル体には未変化体と同等の活性があるが、血中でわずかしこ存在しない (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1.1% [iv, 120hr まで] (1) 糞便中に 55%、尿中に 45% 回収 (1) 【CL】 217～1133mL/min で用量依存性 (10) 2.6mL/min/kg (15) 50mg 投与時 34.4 L/hr, 100mg 投与時 17.2 L/hr (1) 【非腎 CL/総 CL】 100% (10)

【t1/2】 用量依存に延長 (1) 25mg 単回：8hr, 50mg 単回：9.4hr, 100mg 単回：15.8hr (1) 維持期：約 50hr (1) 30hr (15)

【蛋白結合率】 96% (10) 94～97% (1)

【Vd】 4～16L/kg (10) 3.7L/kg (15) 88.1～146L/man (1)

【MW】 358.95

【透析性】 分布容積が比較的大きく蛋白結合率が高いため透析で除去されにくいと思われる (5) 透析されないが、PMMA, EVAL 膜に吸着されるとの報告がある (1)

【TDM のポイント】 PVC に対しての治療域 0.38～1.19 $\mu\text{g/mL}$ (1) 有効治療域 0.25～1.25 $\mu\text{g/mL}$ (1,16, SRL 検査案内) 0.5～2.0 $\mu\text{g/mL}$ (15) 非線形の薬物動態を示すため、増量が必要なときは少量ずつ増量する。中枢神経症状は 1.0 $\mu\text{g/mL}$ 以上での発現が多い (Tsuchishita Y, et al: Biol Pharm Bull 32:637-639,2009) 【OW 係数】 17 (TDM の実際 p 293-313, 薬業時報社,1993) 0.01 [クロロホルム系, pH6] (1) 【pKa】 4.3, 10.2 (1)

【相互作用】 リファンピシンの併用により血中濃度が著しく [C/D 比で 1/6～1/8] 低下 (古久保 拓, 他: 医療薬学 34: 871-5, 2008) ベラパミル併用でアプリンジンの血中濃度上昇 (1) アミオダロン併用でアプリンジンの血中濃度上昇 (1)

【備考】 内服中に手指振戦、眩暈、ふらつきが現れ、増悪する傾向がある場合は直ちに減量又は中止する。

【更新日】 20220628

※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、当院では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。