

◎ノバスタン HI 注, ▼スロンノン HI 注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】アルガトロバン (U) Argatroban 【分類】選択的抗トロンビン剤

【単位】◎10mg/A [2mL]

【常用量】■脳血栓症：2日間60mg/日 24hr 持続点滴静注, その後5日間10mg×2/日 3hr 点滴静注

■ASO：10mg×2/日 2～3hr 点滴静注

■体外循環時の血液凝固防止：開始時プライミングに10mg, その後25mg/hrで持続回路内注射(5～40mg/hrの範囲で調節)

■HIT2型における血栓症の発症抑制：0.7γ(肝障害や出血リスク患者では0.2γ)で開始し, APTTを投与前の1.5～3倍の範囲かつ100秒以下にコントロール

【用法】希釈して点滴静注

【透析患者への投与方法】HIT時の血液透析の抗凝固剤として10mgを回路内に投与(プライミング)し, 透析中は5～40mg/hrを持続投与(1)

持続量は5倍希釈を原則とするため, 60mg/4hrなら生食48mLで計60mLとして, 輸液ポンプを回路に接続して15mL/hrで使用する(1)

脳梗塞急性期[発症48hr以内で病変最大径1.5cm以上]の抗凝固療法には常用量使用(5)

HIT例の透析カテーテルロックに0.5mg/mL(10mg+生食18mLの10倍希釈)濃度で使用する試験プロトコル(Wang Y, et al: Ann Palliat Med 2021 PMID: 33549029)

血管アクセスPTA時にシース挿入後0.1mg/kg静注, 以後6γで持続. 手技終了後0.7γで持続(寒川顕治, 他: 透析会誌 51: 459-462, 2018)

【CRRT】7.8mg/hrでおおよそ1日1回の回路交換で使用できた症例あり(土谷周平, 他: 透析会誌 45:S896, 2012)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし(5)

【特徴】トロンビンの活性部位と立体的に結合することにより, フィブリンの生成作用, フィブリンの安定化作用, 血小板凝集作用を強力に阻害する. しかし高濃度による異常延長は見られない. ATIII低下患者の血液透析時の抗凝固剤として使用されることがある.

【主な副作用・毒性】出血性脳梗塞, ショック・アナフィラキシー, 消化管出血, 肝障害, 消化器症状, 頭痛など

【Tmax】点滴終了時(1)

【代謝】主要代謝部位は肝臓と推定され, 主たる代謝経路はキノリン環の酸化(1) 主要代謝物(3-methyl-1, 2, 3, 4-tetrahydro-8-quinoline (3MTHQ) 環の芳香環化体)の抗トロンビン活性はアルガトロバンの1/40(1) 酸化的代謝にはCYP3A4が主に関与(1) M1の活性は未変化体の1/3～1/5で血中の存在率は未変化体の0～20%(U) ラセミ体の構成比は変化しない(U)

【排泄】尿中未変化体排泄率15%(U) 22.8%(U) 主に胆道系から排泄(1) 尿中に代謝物として1.7%回収(1) 糞便中に未変化体として14%排泄(U)

【CL】252mL/hr/kg(1)

【t1/2】α相15min, β相30min(1) 39～51min(U) 【透析患者のt1/2】β相30min(1)

【蛋白結合率】ヒト血清蛋白: 53.7%, ヒト血清アルブミン: 20.3%(1) 54% [Alb20%, AAG34%](U)

【Vd】212mL/kg(1) 174mL/kgで細胞外液量に影響される(U)

【MW】526.66

【透析性】透析されない(1) ダイアライザー通過前後においても除去されない(松井則明, 他: 人工臓器 11:525, 1982) HD時には非HD時に比べクリアランスが20%上昇する(Murray PT, et al: Kidney Int 66: 2446-53, 2004)

【TDMのポイント】TDMの対象にはならない

【O/W係数】0.031 [クロロホルム系pH6](1)

【pKa】0.5, 11.0(1)

【更新日】20231107

※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.