

◎メトリジン錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】ミドドリン塩酸塩 (U) midodrine 【分類】低血圧治療剤

【単位】◎2mg/錠

【常用量】4～8mg/日

【用法】分2

【透析患者への投与方法】平均8mg (2.5～25mg) の大量投与で透析中のSBPを14mmHg, DBPを5.6mmHg上昇させることができ、副作用も認められない (Clin Nephrol 45: 261-267,1996) という報告があり、活性代謝物のtmaxが1hrであるため、HD前2mgから投与開始し漸増して8mgまで投与量を上げてよい。症例によってはHD中にも投与し、HD透析後の起立性低血圧のある症例にはHD後にも投与する (5)

【その他の報告】非HD日1錠分1, HD日2錠分2 [HD2時間前とHD開始後30分] (基礎と臨床 21:418-428,1987)

透析患者では活性代謝物のdesglymidodrineの半減期が延長するため注意が必要 (Am J Kidney Dis 28: 132-136,1996) HD日は2.5mgを1日2回, 非HD日は1.25mgを1日2回などで調整 (17)

【PD】データなし (17) 【CRRT】5～10mgを8hr毎 (17)

【保存期CKD患者への投与方法】腎不全患者では活性代謝物の半減期が延長するため減量が必要と思われるが、少量から投与開始し血圧の上昇度によって投与量を設定する (5) 【その他の報告】GFR<10mL/minでは50%への減量も考慮 (3) GFR>10mL/min: 5～10mgを8hr毎, GFR 10mL/min未満: データなし (17)

【特徴】交感神経興奮アミンDMAEをグリシンで修飾したプロドラッグで、吸収後加水分解を受け活性本体になる。心臓及び脳血管系に作用せず、末梢血管α1受容体を選択的に刺激し血行動態を正常化 (血管収縮)。血管組織内でも活性体に変換されるため作用発現は緩徐で作用時間が長い。代謝物のdesglymidodrineには迷走神経反射による徐脈効果がある。

【主な副作用・毒性】心室性不整脈、眠気、頭痛、発汗亢進など。甲状腺機能亢進症、褐色細胞腫では禁忌。

【モニターすべき項目】血圧測定、肝機能検査、腎機能検査

【吸収】速やかに吸収され、食物の影響を受けない (1) ka=4.58/hr (1)

【F】90% (10) desglymidodrine 93% (1) ほぼ100% (1)

【tmax】midodrine 30min、desglymidodrine 1～2hr (1)

【代謝】midodrineから活性本体のdesglymidodrineへのdeglycinationはさまざまな組織で起こり、midodrine、desglymidodrineともに一部は肝で代謝される (U) desglymidodrineには活性がある (Am J Kidney Dis 28: 132-136,1996) 経口投与後1～2hrで血中にDMAEが67%、未変化体が28%、DMAEのO-脱メチル体が5%存在 (1)

【排泄】desglymidodrineは腎排泄 (80%が能動的腎尿細管分泌による) (U) midodrineが5%、活性本体のdesglymidodrineが40%、その他非活性体が55%の割合で、投与量の90%以上が24hrで尿中に排泄される (1) 尿中未変化体排泄率75～85% (12) 3.0～4.4% [po, 24hrまで] (1) DMAEとして31.8～42.8% [po, 24hrまで] (1) 尿中回収率76.6% [po, 96hrまで] (1)

【CL】320mL/min [iv] (1) 活性代謝物: 1700mL/min (10) 【非腎CL/総CL】95% (10)

【t1/2】midodrine: 0.5hr、desglymidodrine: 3hr (Grobeck HF, Kees F: Int Angiol 12: 119-24,1993) midodrine: 25min (U) 2hr (1) 0.5hr (10,12)、desglymidodrine 3～4hr (U) 3hr (10) ke=0.196/hr (1) 【透析患者のt1/2】midodrine: 50min, desglymidodrine: 10hr (Blowey DL, et al: Am J Kidney Dis 28:132-6,1996) 4hr (2) 1.5～3hr (12)

【蛋白結合率】24～31%、desglymidodrine 27～28% (6) 低い (U)

【Vd】93.8L/man [po] (1)

【MW】290.74

【透析性】desglymidodrineは透析により除去される (U) HDで3ng/mLが0.3ng/mLに90%除去 【透析時t1/2】1.1hr (4)

【TDMのポイント】TDMの対象にはならない 【O/W係数】0.373 [1-オクタノール/buffer, pH8] (1) 【pKa】7.96 (1)

【効果持続時間】10mg投与後2～3hr

【備考】起立性低血圧症への効果は懐疑的 (FDA 2010)

【更新日】20221027

※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。