▼ラニラピッド錠・▼メチルジゴキシン錠　［内］

【重要度】★★★【TDM】　【一般製剤名】メチルジゴキシン　Methyldigoxin　【分類】強心配糖体
【単位】▼0.05mg/錠，▼0.1mg/錠［ジェネリック］
【常用量】■急速飽和療法（飽和量：0.6～1.8mg）：初回0.2～0.3mg，以後１回0.2mgを１日３回経口投与し十分効果のあらわれるまで続ける
■維持療法：0.1～0.2mg/日
【用法】維持療法は１日１回
【透析患者への投与方法】１回0.05mgを週３～4回服用（5）【その他の報告】本剤の0.15mgがジゴキシン0.25mgに相当することを考慮して初回負荷量・維持量を決定する（佐藤友英，他; 不整脈．南江堂，東京，p223-230,1990）
【保存期CKD患者への投与方法】Ccr＞50mL/min：0.05～0.1mgを24hr毎，Ccr 10～50mL/min：0.05～0.1ｍｇを24hr～48hr毎，Ccr＜10mL/min：0.05mgを週３～4回（5）【その他の報告】Ccr 50mL/min以上：減量の必要なし（Tsutsumi K, et al: J Clin Pharmacol 33: 154-60,1993）
【特徴】ジゴキシンの吸収率が70%前後とよくないのを改善する目的で作られ，ジゴキシンより脂溶性が強いため腸管からの吸収がよく吸収率はほぼ100%であるが血中薬物動態は不明な部分が多い．
【主な副作用・毒性】ジギタリス中毒：食思不振，悪心・嘔吐，易疲労感，頭痛，不眠，抑うつ，黄視，不整脈（房室ブロック，心室性期外収縮，PAT with block）
【安全性に関する情報】
【吸収】吸収率90～100%（日病薬誌 33: 36,1997）
【F】ほぼ100%（1）
【tmax】約1hr［α相］（1）
【代謝】O-脱メチル化によって、ジゴキシンになる（Eur J Clin Pharmacol 9:105,1975）メチルジゴキシン、ジゴキシン、ジゴキシン代謝物（1および2配糖体）は同等の活性があり、その他の代謝物の活性はほとんどない．代謝にはCYP3Aが関与（1）
【排泄】糸球体濾過とP 糖蛋白質を介する尿細管分泌により腎排泄（1）59.7%が尿中に，32.5%が糞中に排泄［iv］（1）総排泄量の40～60%がメチルジゴキシンとして、40～60%がジゴキシンとして、2.5～8.5%がジゴキシン代謝物（0、1、2配糖体）である（中島：臨床薬理 20: 441-6,1989）47%が未変化体として、35%がジゴキシンとして、5.8%が水溶性代謝物として尿中に排泄される。糞便中への排泄率は13%（J Pharmaceut Sci 66: 242-53,1977）未変化体として主に糞便中に排泄される（Kuhlmann J, et al: J Cardiovasc Pharmacol 1: 219-34,1979）【CL/F】179mL/min（1）10.74L/hr（1）【腎CL】46.0mL/min（1）30.3mL/min（Twittenhoff WD, et al:　Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 19: 405-8,1981）【非腎CL/総CL】35%（10）
【t1/2】20～24hr（1）62hr（10）47.8hr（臨床薬理 22: 59,1991）41hr（J Pharmaceut Sci 66: 242-53,1977）【透析患者のt1/2】121.5hr（臨床薬理 22: 59, 1991）
【蛋白結合率】29.8%（1）10%（J Pharmaceut Sci: 66:242-253,1977）29%（日病薬誌 33: 36,1997）
【Vd/F】9.45L/kg（1）無尿患者258L/man（Twittenhoff WD, et al; Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 19: 405-408,1981）【分布】脳への移行は単回投与ではジゴキシンよりも高く、脳内からの消失半減期は154hr（Kuhlmann J, et al: J Cardiovasc Pharmacol 1: 219-234,1979）
【MW】824.00
【透析性】Vdが大きいため効率的には除去できない（5）
【TDMのポイント】有効地領域は血清ジゴキシン濃度として0.8～2.0ng/mLでジゴキシン0.25mg投与者の血清ジゴキシン濃度はラニラピッド0.1mg服用者の血清ジゴキシン濃度とほぼ同等（1）血中に入ると20～30%がジゴキシンに変化する．そのため血中ではジゴキシンとメチルジゴキシンが混在し，血中濃度は血中ジゴキシン値を測定してその値の1.4～1.7倍を薬物血中濃度とみなすという説がある．ジゴキシンの血中濃度と同じにするにはジゴキシンの1.3倍の量を投与する必要がある．ジゴキシンに比し血中薬物動態が不明な部分が多い．FPIA法では活性を有する代謝物のdigoxigenin-bis-digitoxoside，digoxigenin monodigitoxoside，digoxigeninとも交差反応するが，活性のないdihydrodigoxinとは交差反応しない（ダイナボット社TDX DIGOXIN ・添付文書）本法ではβメチルジゴキシンのジゴキシンとの交差率は71～96%と幅広い．CLIA法ではジゴキシンに対し68%の交差率を示す（バイエルメディカル株式会社・ケミルミ ACS-ジゴキシン・添付文書）ジゴキシンと比べ同量投与で得られる血中濃度は1.4～1.7倍（三浦崇則: 月刊薬局 増刊号, 2004）

【相互作用】Ca注射剤と原則併用禁忌（1）抗不整脈薬，血清電解質異常に関連する薬剤との併用注意（1）その他ジゴキシン参照.
【効果発現時間】5～20分（1）5～10分（日病薬誌33: 36,1997）
【効果持続時間】5～8時間（日病薬誌33: 36, 1997）
【更新日】20241002

※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。