

◎ピメノールカプセル [内]

【重要度】★【TDM】 【一般製剤名】ピルメノール塩酸塩水和物 Pirmenol Hydrochloride Hydrate 【分類】持続性不整脈治療剤 [クラス Ia]

【単位】◎50mg・▼100mg/Cap

【常用量】200mg/日

【用法】分2

【透析患者への投与方法】50mg/日投与し、効果不十分であれば100mg分2投与 (Ther Res 20: 1141-6, 1999)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr 10mL/min 以上：減量の必要なし、Ccr<10mL/min：150mg/日に減量 (5)

【その他の報告】Ccr 30~70mL/min：t1/2 が 1.5 倍に延長、AUC が 2 倍に増大、Ccr 30mL/min 未満：t1/2 が 1.5 倍に延長、AUC が 3 倍に増大 (1)

腎機能障害患者には慎重投与 (1)

加齢による PK に差はない (Ferry DG, et al: Eur J Clin Pharmacol 1992 PMID: 1451728)

【特徴】クラス Ia の抗不整脈剤。心機能抑制作用は弱く抗コリン作用も弱い。半減期も比較的長いことから 1 日 2 回の投与に設定され、頻脈性不整脈 (心室性) に有効。

【主な副作用・毒性】心室頻拍、心室細動、房室ブロック、失神、QT 延長、ショック、低血糖、口渇、口中苦味、消化器症状、排尿障害、視覚障害など

【安全性に関する情報】失神、めまい、ふらつき、手足のしびれ等があらわれることがあるので、自動車の運転など危険を伴う機械の操作に従事させないように注意 (1)

【F】83% (1) 87% (Lee TG, et al: J Cardiovasc Pharmacol 5: 632-637,1983) 82.6% (Hammill, et al: Clin Pharmacol Ther 32: 686-91,1982)

【tmax】約 1.3hr (1) 透析患者 3.5hr (小河原滋子, 他: Ther Res 20: 1141-1146,1999) 1~1.5hr、200mg 投与で Cmax は 1.8 μg/mL、250mg 投与で Cmax は 2.7 μg/mL、300mg 投与で Cmax は 3.4 μg/mL (Garg DC, et al: J Clin Pharmacol 28: 812-7,1988)

【代謝】ピペリジン環脱水素体 (M-2) が数%生成する (1) 代謝物の M-2、M-3、M-5 には抗不整脈作用がある (1) グルクロン酸抱合を受ける (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 17~25% (1) 30% (14) 31% (Garg DC, et al: J Clin Pharmacol 28: 812-7,1988)

【CL】13.83±3.47L/hr (1) 210mL/min (10) (-)体は(+)体比し CL が 20%高い (Janiczek N, et al: J Clin Pharmacol 37: 502-13,1997) 3.0mL/min/kg (Lee TG, et al: J Cardiovasc Pharmacol 5: 632-7, 1983)

腎 CL 46.6±21.2mL/min で、全身 CL の 30±10% (Sanders SW, et al: J Clin Pharmacol 1983 PMID: 6853743)

【非腎 CL/総 CL】70% (10)

【t1/2】7hr (10,14) 7~9hr (1) 9.3hr (Hammill, et al: Clin Pharmacol Ther 32: 686-91,1982, Garg DC, et al: J Clin Pharmacol 28: 812-7,1988) 6.5hr (Lee TG, et al: J Cardiovasc Pharmacol 5: 632-7,1983) 透析患者 15.1hr (Ther Res 20: 1141-6,1999) 腎不全患者 13hr (1)

【蛋白結合率】80%前後 (1) 87% (10) 77.5%, 主に AAG と結合し蛋白結合率は AAG 濃度と正相関する (植田孝子, 他: 臨床薬理 22: 611-6,1991) 86.6% (Hammill, et al: Clin Pharmacol Ther 32: 686-91,1982)

【Vd】99.29±21.86L/man (1) 1.3L/kg (10,14) Vc=0.70L/kg (Lee TG, et al: J Cardiovasc Pharmacol 5: 632-7,1983) 1.45L/kg (Sanders SW, et al: J Clin Pharmacol 1983 PMID: 6853743)

【MW】392.97 [塩酸塩水和物]

【透析性】6.9±1.7% (小河原滋子, 他: Ther Res 20: 1141-6,1999)

【TDM のポイント】最小有効濃度 0.4 μg/mL (1, LSI 検査案内 2014) 有効治療域 1~3.8 μg/mL (14) 有効治療濃度 400ng/mL 以上 (SRL 検査案内) 0.7~2 μg/mL で心室性期外収縮を 90%抑制できる (Hammill, et al: Clin Pharmacol Ther 32: 686-91,1982) 1.5 μg/mL が最低有効濃度 (Janiczek N, et al: J Clin Pharmacol 37: 502-13,1997)

有効者のトラフ濃度 0.98±0.29 μg/mL (Ellenbogen KA, et al: Clin Pharmacol Ther 1987 PMID: 3665339)

母集団体内動態解析 (Kasai H, et al: Eur J Clin Pharmacol 1999 PMID: 10206089)

抗コリン性副作用は血清濃度 1.5 μg/mL 未満では生じず、尿閉を予防するための指標と考えられる (Tsuchishita Y, et al: Jpn J TDM 27:124-9, 2010)

【O/W 係数】1.25 (1) [1-オクタノール/水系, pH7] (1) 【pKa】3.89, 10.21 (1)

【相互作用】シメチジン併用による影響はない (Stringer KA, et al: J Clin Pharmacol 32: 91-4, 1992) QT 延長のリスクから、バルデナフィル、モキシフロキサシン、アミオダロン注射剤、トレミフェンとの併用禁忌 (1)

【更新日】20221110

※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。