

◎メインテート錠, ○ビソプロロール fumarate 酸塩錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】ビソプロロール fumarate 酸塩錠 (U) Bisoprolol Fumarate 【分類】選択的β1遮断薬

【単位】◎0.625mg・△2.5mg・◎5mg/錠

【常用量】■高血圧：5mg/日 ■慢性心不全：0.625mg から開始，2週間以上投与して忍容性がある場合に1.25mg/日に増量。その後忍容性がある場合には，4週間以上の間隔で忍容性をみながら段階的に増量し忍容性がない場合は減量。用量の増減は1回投与量を0.625, 1.25, 2.5, 3.75 又は5mg として必ず段階的に行い，維持量1.25～5mg/日 ■頻脈性心房細動：2.5mg から開始し，効果不十分なら最大5mg/日

【用法】分1

【透析患者への投与方法】2.5mgを24hrおき(10)

【その他の報告】50%に減量(3,12,17) HD患者に対する2.5mg/日は腎機能正常者に5mg/日投与と同等の血中濃度(Kanegae K, et al: Int J Artif Organs 22: 798-804, 1999 PMID: 10654875)

【PD】50%に減量(3,17)

【CRRT】50%に減量(17)

【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未満：2.5mg/日(10)

【その他の報告】Ccr 10～50mL/min：減量の必要なし，Ccr 10mL/min未満：50%に減量(10)

Ccr 10～50mL/min：75%に減量，Ccr 10mL/min未満：50%に減量(12,17, Munar MY, et al: Am Fam Physician 75:1487-96, 2007)

【特徴】β1選択性アンタゴニストでISAをもたない。アテノロールやメトプロロールよりもβ1選択性が高い。少量からの開始で慢性心不全へも適用できる。

【主な副作用・毒性】徐脈，洞不全症候群，房室ブロック，めまい，ふらつき，倦怠感，立ちくらみ，肝機能障害，クレアチニン上昇，霧視など

【モニターすべき項目】CBC，血糖値(DM患者)，ECG，心機能，肝機能，腎機能，血圧

【吸収】吸収率80～90%(U) 90%(10) 食事の影響を受けない(1) 酸性条件で溶解性が低下してFに影響している可能性(Ishida K, et al: Drug Metab Pharmacokinetics 28: 491-6, 2013 PMID: 23719964)

【F】88%(1) 初回通過効果は10%以下(11)

【tmax】3.1±0.4hr(1)

【代謝】肝で代謝(U) CYP2D6, 3A4で代謝される(1) M4には弱い活性があるが存在率は低い(1)

【排泄】尿中未変化体排泄率50%(U,12) 48% [po, 72hrまで](1) 糞便中未変化体排泄率2%以下(U)

【CL】250mL/min(10) 8L/hr(1) 高齢者のPPK解析よりCL/F [L/hr] =0.0612×体重+1.15×Ccr (Taguchi M, et al: Biol Pharm Bull 28: 876-81, 2005 PMID: 15863897) 【非腎CL/総CL】50%(10)

【t1/2】9～12hr(U) 9hr(1) 10～12hr(10,11) 9～13hr(12) 【透析患者のt1/2】18～24hr(10,12)

【蛋白結合率】26～33%(U) 30%(10) 30～35%(12)

【Vd】2.5L/kg(1) 3L/kg(10,11,12)

【MW】766.6(遊離体325.3)

【透析性】透析で除去されない(U) 透析クリアランスは無視できないものの，Vdが比較的大きく，効率的には除去できないと思われる(5)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない。治療上有効な濃度は10～100ng/mL(1)

【薬物動態】腎障害患者を含むPK解析(Li GF, et al: Acta Pharmacol Sin 33: 1359-71, 2012 PMID: 23085739)

【O/W係数】4.8(11) 資料なし(1) 【pKa】9.31

【相互作用】心抑制作用，徐脈作用を有する薬剤との併用注意(1) リファンピシム併用によりAUCが34%低下する(Kirch W, et al: Eur J Clin Pharmacol 31: 59-62, 1986) フィンゴリモドと併用で徐脈と心ブロックに注意(1) 低血糖症状のマスクに注意(1)

【主な臨床報告】カルベジロールよりもHD患者の2年予後，MACEsを抑制するかもしれない[HD時血圧低下が少ない影響か?](Wu PH, et al: Clin Kidney J 2021 PMID: 33779636)

カルベジロールよりも心房細動患者の心拍数低下作用が強い。(Yamashita T, et al: J Cardiol 2019 PMID: 30591320)

【最大効果発現時間】1.5hr(5mg投与)

【効果持続時間】24hr(5mg投与)

【備考】慢性心不全に対しては少量より漸増する。

【更新日】20240530

※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。