○ピモベンダン錠　［内］

【重要度】　【一般製剤名】ピモベンダン　Pimobendan　【分類】心不全治療薬
【単位】▼0.625mg・○1.25mg・▼2.5mg/錠
【常用量】2.5～5mg/日
【用法】■急性心不全：1回2.5mg［病態に応じ1日2回まで．必要に応じてジギタリス剤と併用する］
■慢性心不全（軽症～中等症）：1回2.5mg1日2回食後［ただし、ジギタリス剤，利尿薬と併用］
【透析患者への投与方法】初回1.25mg～2.5mg/日から開始し，2～3週間後に5mgに増量．運動耐用能の改善により2.5mg/日に減量（松井 豊，他: Pharma Medica 15: 159-70,1997）
【その他の報告】1回1.25mg1日2回など低用量から開始（1）減量の必要なし（Przechera M, et al: Eur J Clin Pharmacol 40: 107-11,1991 PMID: 2060537，関口浩司，他: Pharma Medica 14:161-8,1996）未変化体および代謝物の体内動態は腎不全の影響を受けない（松井 豊，他: Pharma Medica 15: 137-44,1997）
【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：初回1.25mg～2.5mg/日から開始し2～3週間後に5mgに増量．QOLが改善すれば2.5mg/日に減量（松井 豊，他: Pharma Medica 15: 159-70,1997）
【特徴】ベンズイミダゾール誘導体の抗心不全剤．心筋Ca感受性増強作用を有し，PDE-III活性抑制作用も有する．これらの作用によりエネルギー効率のよい陽性変力作用と血管拡張作用を表す．肝代謝により脱メチル体になるがこの脱メチル体の陽性変力作用およびPDE活性抑制作用は未変化体の34倍および，12.6倍と報告されている．
【主な副作用・毒性】心室細動、心室頻拍、血圧低下、肝障害、白血球・血小板減少など
【安全性に関する情報】不整脈・血圧低下に注意して2.5mg/日を上限として使用するのが望ましい（5）突然死が増加（有意ではない）との報告がある（PICO trial: Heart 76: 223-31-1996 PMID: 8868980）
【モニターすべき項目】血圧、心拍数、心電図、尿量等（1）
【吸収】小腸全体で吸収される（1）
【F】初回通過効果を受け，66±19%（1）51～55%（Chu KM, et al: Drug Metab Dispos 27: 701-9, 1999）
【tmax】未変化体1hr，脱メチル体1.3hr（1）
【代謝】肝代謝され，抱合体にも変換される（1）脱メチル体の陽性変力作用およびPDE活性抑制作用は未変化体の34倍および12.6倍（1）代謝にはCYP1A2と3A4が関与［ラット］（1）代謝へのCYP3A4の関与はマイナーで，O-脱メチル化にはCYP1A2が関与（Kuriya S, et al: Drug Metab Dispos 28: 73-8, 2000）
【排泄】主に糞便に排泄され，尿中回収率20～40%［代謝物として］（1）
【CL】CL/F=2940mL/min［po］（1）（＋）体13.5mL/min/kg，（－体）14.4mL/min/kg［iv］（Chu KM, et al: Drug Metab Dispos 27: 701-9, 1999）
【t1/2】未変化体1hr，脱メチル体2hr（1）心不全患者で未変化体1.4hr，脱メチル体3.2hr（1）
【蛋白結合率】97～99%（1）代謝物を含め92%以上（Chu KM, et al: Drug Metab Dispos 27: 701-9, 1999）
【Vd】Vd/F=228L/man（1）（＋）体1.74L/kg，（－）体2.34L/kg［iv］（Chu KM, et al: Drug Metab Dispos 27: 701-9, 1999）
【MW】334.38
【透析性】未変化体，主代謝物ともにほとんど除去されない［ダイアライザを通過しない］（1）
【TDMのポイント】TDMの対象にならない．EC50は6.5ng/mL（Chu KM, et al: Drug Metab Dispos 27: 701-9, 1999）
【薬物動態】2-コンパートメントモデルに適合し，各エナンチオマーのPKは類似している（Chu KM, et al: Eur J Clin Pharmacol 47: 537-42, 1995）
【O/W係数】2000［1-オクタノール/水系，pH7］（1）【pKa】4.7，11.3（1）
【主な臨床報告】日本人において，CHF患者の複合心イベント（心不全死，不整脈死，突然死，心不全入院＋運動耐用能）を有意に改善したが，心イベント自体は有意な改善はなし（EPOCH trial: Circ J 66: 149-57, 2002 PMID: 11999639）

【効果発現時間】30分～1時間（1）
【効果持続時間】12時間（1）
【更新日】20230516

※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。