

◎アイトロール錠, ○一硝酸イソソルビド錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】一硝酸イソソルビド Isosorbide Mononitrate (ISMN) 【分類】狭心症治療薬 [硝酸イソソルビド製剤]
【単位】▼10mg・◎20mg/錠
【常用量】40mg/日 [最大 80mg]
【用法】1 日 2 回
【透析患者への投与方法】減量の必要なし (5) 【その他の報告】HD 日はHD 後に投与 (12)
【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (3,12)
【特徴】立体構造上、肝臓のグルタチオン-S-トランスフェラーゼによる脱ニトロ化をうけにくいいため、他の硝酸・亜硝酸エステル系薬剤に比べて肝臓での初回通過効果を受けにくく消失半減期が長いことから高い生体内利用率を示す。
【主な副作用・毒性】頭痛、頭重感、眩暈、動悸、血圧低下、起立性低血圧など
【吸収】高脂肪食摂取により AUC が大きくなるが、硝酸イソソルビド徐放剤に比し、食事の影響を受けにくい (1)
【F】ほぼ 100% (1) 93% (13)
【tmax】1.5～1.8hr (1) 1～1.5hr (13) 【Cmax】20mg を 4 日間経口投与したときの Cmax は 314～2093nM (13)
【代謝】主に肝臓で代謝される (1)
【排泄】尿中に未変化体 2%, イソソルビド 42%, ISMN のグルクロン酸抱合体 29%が回収 (1) 腸肝循環を受ける (1) 尿中未変化体排泄率 5%以下 (12,13) 【CL】6～6.2L/hr (1) 1.80mL/min/kg (13)
【t1/2】5～6hr (1) 4.9hr (12,13)
【蛋白結合率】2.5～3.9% (1) 蛋白と結合しない (13) 5% (12)
【Vd】40.7～42.1L/man (1) 0.73L/kg (12,13) 【分布】血液脳関門、血液胎盤関門を通過する (1)
【MW】191.14
【透析性】平均血漿濃度は約 80%減少するが透析終了後の血漿濃度が治療域に保たれていた (1)
【TDM のポイント】有効治療濃度は 500nM 以下 (13) 安全性が高いため TDM の対象にはならない 【O/W 係数】0.3 [クロロホルム系] (1) 【pKa】解離しない (1)
【相互作用】PDE5 阻害剤・GS 刺激剤との併用で過降圧のおそれあり併用禁忌 (1)
【効果発現時間】2hr (日本医薬品総覧)
【効果持続時間】7hr (日本医薬品総覧)
【備考】肝障害患者で副作用が発生しやすい傾向にある (1)
【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。