

△ハイパジールコーワ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ニブラジロール Nipradilol 【分類】 高血圧・狭心症治療剤

【単位】 △3mg・▼6mg/錠

【常用量】 6～12mg/日 [最大 18mg]

【用法】 1日2回

【透析患者への投与方法】 おそらく減量の必要がないと思われる (5)

【その他の報告】 Ccr 20mL/min 以下では減量が必要 (両角國男, 他: 医学と薬学 24: 1559-64, 1990)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 脂溶性β遮断薬であるため減量の必要性はないと思われる (5)

【特徴】 β遮断作用に加えてニログリセリンに類似した血管拡張作用を有する。β遮断作用は非選択的ISAやMSAを示さず、プロプラノロールの2～3倍のβ遮断作用を示すが、心筋収縮力抑制作用は1/3程度。

【主な副作用・毒性】 徐脈, 脱力倦怠感, 眩暈, 頭痛・頭重, 眠気, 末梢循環障害, 悪心・嘔吐, 心胸郭比増大, 食欲不振, 喘息様症状, 腹痛など

【吸収】 ラットでは迅速かつ良好に消化管より吸収される (Kabuto S, et al: Arzneimittelforschung 35: 1674-9, 1985)

【F】 35% [ただし尿中排泄率から計算] (1) ラットでは初回通過効果が飽和する (Kabuto S, et al: Arzneimittelforschung 35: 1674-9, 1985)

【tmax】 2hr (1) 1.5hr (海老原昭夫, 他: 臨床薬理 17: 391-401, 1986)

【代謝】 肝で主にグルクロン酸抱合体および脱ニトロニブラジロールとなる (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 7% [po, 24hr まで] (1) F が 35%なので, 実際の尿中排泄率は 20% (5) 尿中回収率 59.2% [po, 24hr まで] (1)

【CL】 1040mL/min, 腎 CL 180mL/min (1)

【t1/2】 3.7hr (1) 6hr (海老原昭夫, 他: 臨床薬理 17: 391-401, 1986)

【蛋白結合率】 34% [Alb 11%, AAG 26%] (1)

【Vd】 5.6L/kg (1)

【MW】 326.34

【透析性】 透析膜を通過する (1) 全身クリアランスが大きいこと, Vd が比較的大きいことより, HD 除去の寄与は大きくないと思われる (5)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない 【O/W 係数】 0.85 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】 9.58

【相互作用】 PDE 阻害剤, sGC 活性化剤 [リオシグアト] との併用禁忌 (1)

【効果発現時間】 30分

【更新日】 20220115

※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。