

▼アペマイド錠 [内]

【重要度】★★★【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】クロルプロパミド (U) chlorpropamide 【分類】経口糖尿病用剤

【単位】▼250mg/錠

【常用量】100～125mg/日 [最大 500mg]

【用法】分1 (朝食前または後)

【透析患者への投与方法】未変化体、活性代謝物 (Jonsson A, et al: Eur J Clin Pharmacol 53: 429-35,1998) が腎不全患者では蓄積しやすい (Clin Pharmacokinet 31: 111-9,1996) ため使用を避ける (5)

【その他の報告】重篤な腎機能障害のある患者では低血糖を起こすおそれがあるため禁忌 (1)

透析患者でも薬物動態には大きな変化はないが、同一投与量でもインスリン分泌は亢進する (Am J Kidney Dis 29: 907-11,1997)

減量の必要なし (10) 避ける (3,17)

【PD】避ける (3,17)

【CRRT】避ける (3,17)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr>50mL/min : 減量の必要なし, Ccr10～50mL/min : 活性代謝物が蓄積し低血糖が遷延しやすいためできるだけ投与を避ける, Ccr<10mL/min : 禁忌 (5)

【その他の報告】慎重投与 (1) Ccr>50mL/min : 常用量を 24～36hr 毎もしくは常用量の 50%に減量, Ccr<50mL/min : 避ける (3,10,12)

GFR>50mL/min : 50～250mg を 24hr 毎, GFR 50mL/min 以下 : 低血糖リスクのため投与を避ける (17)

血清クレアチニンと薬物血中濃度に相関はない (Bergman U, et al: Eur J Clin Pharmacol 18: 165-9, 1980 PMID: 7428798)

【特徴】体内で代謝されにくく作用持続時間が長い。半減期はトルブタミドの 10 倍。一度低血糖を起こすと遷延するため高齢者には使用しない方がよい。

【主な副作用・毒性】低血糖、再生不良性貧血、無顆粒球症、肝機能障害、腹部不快感、発疹、ジスルフィラム様作用、甲状腺機能異常、知覚異常、体温低下、低 Na 血症など

【モニターすべき項目】血糖値、CBC、尿糖、尿中ケトン体、HbA1c、血漿浸透圧、血清 Na・K、血清 pH

【吸収】経口投与後、消化管上部よりすみやかに吸収される (1) 食事により吸収が遅延するが (U) 吸収量には変化なし (11) 90%以上 (13)

【F】

【tmax】2～4hr (1,U) 3～6hr (11) 1～7hr (13) 【Cmax】250mg を単回経口投与後 30～35 μg/mL (13)

【代謝】肝臓で代謝される (1) 代謝物の活性はなし (11) 主として CYP2C9 により 2-水酸化体で代謝 (Shon JH, et al: Br J Clin Pharmacol 59: 552-63, 2005 PMID:15842554)

【排泄】尿中未変化体排泄率 20% (13) 6～20% (U) 47% (12) 尿中回収率 99% (1)

【CL】1.60mL/hr/kg (1) 0.04mL/min/kg (13)

【t1/2】36hr (1,U) 33hr (13) 24～48hr (12) 【腎不全患者の t1/2】Ccr<50mL/min : 200hr に延長 (11) 50～200hr (12)

【蛋白結合率】95.6% (1) 90%以上 (U) 96% (13) 91～99% (12)

【Vd】106mL/kg (1) 0.09～0.27L/kg (U) 0.14～0.21L/kg (11) 0.097L/kg (13) 0.09～0.27L/kg (12)

【MW】276.74

【透析性】蛋白結合率が高いため、効率的には除去できないと思われる (5)

【TDM のポイント】有効血中濃度 : 40.5～116 μg/mL (1) 【O/W 係数】資料なし (1)

【効果発現時間】1hr 以内 (1)

【効果持続時間】24hr またはそれ以上 (1)

【更新日】20151210

※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。