

	スマトリブタン	ゾルミトリブタン	エレトリブタン	リザトリブタン	ナラトリブタン
規格	50mg	2.5mg	20mg	10mg	2.5mg
Tmax	1.8～2時間	中央値3時間 (1～5)	1～1.2時間	1～1.3時間	2.4～2.6時間
T1/2	2.2～2.4時間	2.4～2.9時間	3.2～3.9時間	1.6～1.7時間	5～5.3時間
投与間隔	2時間	2時間	2時間	2時間	4時間
1回最大用量	100mg	5mg	40mg	倍量なし	倍量なし
1日最大用量	200mg	10mg	40mg	20mg	5mg
食事の影響 (食後)	【影響あり】 Tmax30分程度遅延 Cmax、t1/2及び AUC同様	【臨床上的の影響なし】 Cmax、AUC が13%、16%低下した (有意差なし)	【影響あり】 Tmax 1 時間遅延 Cmax 27%、AUC 30%増加	【臨床上的の影響なし】 Tmaxは1.4±0.4時間⇒2.7±1.0時間で遅延 (有意差なし)	【臨床上的の影響なし】 薬物動態はほぼ同様
肝機能障害	【重度肝機能障害禁忌】 AUC及びCmaxは約 1.8 倍に上昇 Tmax 及び t1/2に関しては大きな差は認められなかった	・ AUC、Cmaxが中等度で94%、50%増加、重度で226%、47%増加	【重度肝機能障害禁忌】 ・ 軽度、中等度 AUC は35%増加	【重度肝機能障害禁忌】 ・ 中等度 AUCは約30%増加	【重度肝機能障害禁忌】 Cmaxはほぼ同様。 AUC は48%増加し、t1/2 は42%延長。
腎機能障害	—	—	—	【透析患者禁忌】 血液透析患者 AUCが44%増加	【重度腎機能障害禁忌】 軽度、中等度： Cmax が39%、43%上昇 t1/2 が 86%、62%延長
バイオアベイラビリティ	約14%	約40%	46.90%	45～48%	70%
蛋白結合率	約34%	約20%	87%	14%	29%
妊婦	有益性投与	有益性投与	有益性投与	有益性投与	有益性投与
授乳婦	本剤投与後 12 時間は授乳しないことが望ましい 乳汁中濃度は投与量の 0.24% 体重換算すると 乳児への移行量は、母親の投与量の 3.5%	授乳を避けさせること	授乳しないことが望ましい。 母乳への移行が極めて少ない は投与後 24 時間までにヒト母乳中に約 0.02%の移行	有益性投与 乳汁中に血漿中濃度の6倍以上移行した (ラット)	有益性投与
代謝に関与	MAO-A	MAO-A、CYP1A2	MAO-A、CYP3A4 IR (阻害率) 0.88のCAMとの併用でAUCが4倍になるため、CYP3A4基質寄与率は0.85	MAO-A	—
プロプラノロール	薬物動態変化なし	体内動態に臨床問題となるような影響はなし	Cmaxは 1.1 倍、AUC は 1.3 倍に増大し、T1/2は 4.9 時間から 5.2 時間 (差は小さい) 臨床的に問題となる血圧への影響は認められなかった	【併用禁忌】 AUCが1.67倍、Cmaxが1.75倍に増加し、t1/2は1.3倍に延長	—