

▼プロチアデン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ドスレピン塩酸塩 dosulepin hydrochloride (dothiepin) 【分類】 三環系抗うつ薬

【単位】 ▼25mg/錠

【常用量】 75～150mg/日

【用法】 1日2～3回

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (1) 【その他の報告】 高齢者と若年者の PK に違いはみられない (Bareggi SR, et al: Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry 14: 163-70, 1990)

【特徴】 アミトリプチリン類似の三環系抗うつ薬でモノアミン取り込み阻害作用がある。モノアミン再取り込み抑制作用は、アミトリプチリンと同等かやや弱い。アミトリプチリンより抗コリン作用が弱いとされる。

【主な副作用・毒性】 口渇、眠気、めまい、ふらつき、立ちくらみ、便秘、悪性症候群、SIADH、無顆粒球症、イレウス、肝障害など。

【安全性に関する情報】 中毒時の心室性不整脈にフィゾスチグミンが有効 (Schulz M, et al: Pharmazie 49: 614, 1994)

【F】 初回通過効果を受けて 30% (1)

【tmax】 3～5hr (1) 2～5hr (Maguire KP, et al: Br J Clin Pharmacol 12: 405-9, 1981)

【代謝】 CYP2D6 で代謝 (1) 活性代謝物ノルチアデンは未変化体と同等かより強い作用を有し、ノルチアデン-S-オキシドおよびドスレピン-S-オキシドの活性は未変化体の 1/5～3/5 (1) 主代謝物 S-オキシドで、次いでノルチアデン (Maguire KP, et al: Br J Clin Pharmacol 12: 405-9, 1981)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 0.09% [24hr まで] (1) 尿中にドスレピン-S-オキシド 23.3%、ノルチアデン 0.07%、ノルチアデン-S-オキシド 0.8%が回収 [24hr まで] (1) 【CL】 1.4～3.8mL/hr/kg (1) CL/F=1.36 [範囲 0.88～1.8] L/hr/kg [po] (Maguire KP, et al: Br J Clin Pharmacol 12: 405-9, 1981) 2.1±1.6L/hr/kg (Maguire KP, et al: Clin Pharmacokinetics 8: 179-85, 1983)

【t1/2】 14～22hr (1) 高齢者で遅延 (1) ノルチアデン: 35～45hr、ドスレピン-S-オキシド: 23～26hr、ノルチアデン-S-オキシド: 24～34hr (1) 22hr [範囲 14～40], S オキシド 19hr (Maguire KP, et al: Br J Clin Pharmacol 12: 405-9, 1981) 未変化体 25hr, S オキシド 22hr、ノルチアデン 31hr (Maguire KP, et al: Clin Pharmacokinetics 8: 179-85, 1983) 半減期は活性炭投与で軽度短縮 (Ilett KF, et al: Ther Drug Monit 13: 485-9, 1991)

【蛋白結合率】 93.7～94.4% (1)

【Vd】 40～78L/kg (1) 45 [範囲 20～92] L/kg (Maguire KP, et al: Br J Clin Pharmacol 12: 405-9, 1981) Vd/F=70±62L/kg (Maguire KP, et al: Clin Pharmacokinetics 8: 179-85, 1983)

【MW】 331.90

【透析性】 資料なし (1) 除去されない (5)

【O/W 係数】 資料なし (1) 【pKa】 8.3 (1)

【相互作用】 MAO 阻害剤と併用禁忌 (1)

【更新日】 20170123

※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。