

## ◎ドグマチール錠 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】スルピリド Sulpiride 【分類】ベンザミド系抗潰瘍・精神安定剤

【単位】◎50mg/錠

【常用量】■胃・十二指腸潰瘍：150mg/日

■統合失調症：300～600mg/日 [最大1200mg]，1回100～200mg筋注 [最大600mg/日筋注]

■うつ病・うつ状態：150～300mg/日 [最大600mg]

【用法】分3

【透析患者への投与方法】1日25mg～週3回HD後に50mg (5)

【その他の報告】腎機能が低下している患者には投与量を35～70%に減量し，さらに投与間隔も1.5倍～3倍に延長する (Bressolle F, et al: Clin Pharmacokinet 1989 PMID: 2582694) 投与量を1/3程度あるいは35～70%に減量し，さらに投与間隔も48hrあるいは1.5倍～3倍に延長する (臨床精神医学 20: 265-73,1991) 蓄積し半減期も延長するため減量 (11)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr>50mL/min：常用量の50～100%，Ccr 10～50mL/min：常用量の20～50%，Ccr<10mL/min：1回量を2～3日毎 (5)

【その他の報告】Ccr<10mL/min：1/3以下に減量。または以下で減量：Ccr 30～60mL/min：70%，Ccr 10～30mL/min：50%，Ccr 10mL/min未満：35% (18) 腎機能低下例では最大70%減量するか半減期を3倍に延長することを推奨 (Bressolle F, et al: Clin Pharmacokinet 1989 PMID: 2582694)

【特徴】抗潰瘍剤としては胃運動の促進作用，血流増化作用，粘液分泌刺激作用，中枢性酸分泌抑制作用が認められている。統合失調症ではハロペリドールに比して即効性に優れるが鎮静作用がほとんどないため意識水準の低下がほとんど見られず，錐体外路系の副作用もクロルプロマジンやハロペリドールに比較して弱いなどの利点がある。

【主な副作用・毒性】悪性症候群，痙攣，QT延長，血球減少，肝障害，無月経，女性化乳房，錐体外路系症状，嘔吐，発疹など

【吸収】25～40%，食物の存在下で吸収が低下し，重曹・シメチジンの併用により胃内pHが上がるため吸収が低下する (11)  $ka=9.36\pm 1.84/hr$  [im] (1)

【F】 $27\pm 9\%$  (1) 平均35%であるが，10～70%と個人差が大きい (Bres J, et al: J Pharm Sci 80: 1119-24,1991 PMID: 1815069) 30% (Bressolle F, et al: J Pharm Sci 1992 PMID: 1619566)

【tmax】1～3hr (11)

【代謝】代謝されない (1, Bres J, et al: J Pharm Sci 80: 1119-24, 1991) 尿中代謝物は5-oxypyridine体の一種類 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率93.1% (Bressolle F, et al: J Pharm Sci 73: 1128-36,1984)  $90.0\pm 9.68\%$  (Bres J, et al: J Pharm Sci 80: 1119-24,1991) 93% [im, 48hrまで] (1) OCT1/2の基質 (1)

【CL】 $7.2\sim 10.7L/hr$  (11)  $CL/F=89.8mL/min$  [im] (Bressolle F, et al: J Pharm Sci 73: 1128-1136, 1984)  $127.8\pm 26.2mL/min$  (Bres J, et al: J Pharm Sci 80: 1119-24, 1991)  $CL/F=36.4\pm 10.4L/hr$  (1)

【腎CL】 $83.0mL/min$  (Bressolle F, et al: J Pharm Sci 73: 1128-36,1984)  $119.5\pm 28.2mL/min$  (Bres J, et al: J Pharm Sci 80: 1119-24, 1991) OCT2により血中から尿管上皮細胞に取り込まれ，MATEが尿管への分泌に関与し，OCTNが分泌と再吸収に関与している (Li L, et al: Biopharm Drug Dispos 2017 PMID: 28926871) OCT1, OCT2, MATE1, MATE2-Kの基質である (Takano H, et al: J Pharm Sci 2017 PMID: 28499878)

【t1/2】錠剤：4～10hr，カプセル：6～8hr (11)  $\alpha$ 相6.93min， $\beta$ 相0.22hr， $\gamma$ 相6.74hr (Bressolle F, et al: J Pharm Sci 1984 PMID: 6491918) 6.47hr (Bres J, et al: J Pharm Sci 1991 PMID: 1815069) 6.7hr [im] (1)  $ke=0.112\pm 0.026/hr$  [im] (1)

【蛋白結合率】3.6～4.5% (1) 14～40% (11) 結合しない (Bres J, et al: J Pharm Sci 80: 1119-24,1991)

【Vd】 $1\sim 1.8L/kg$  (11)  $Vd/F=17.03\pm 6.11L/kg$  (1)  $Vss=0.64\pm 0.18L/kg$  [im] (1) 初期  $0.145L/kg$ ，定常状態  $0.639L/kg$  (Bressolle F, et al: J Pharm Sci 73: 1128-36,1984)  $0.94L/kg$  (Bres J, et al: J Pharm Sci 80: 1119-24,1991)

【分布】脂溶性が低いため，脳脊髄液には血漿濃度の約1/13しか移行しない (11) 血漿濃度と赤血球内濃度はほぼ全く同じ (Bres J, et al: J Pharm Sci 80: 1119-24, 1991)

【MW】341.43

【透析性】透析されると思われる (5) 除去率  $33.6\pm 4\%$  [iv] (1)

【TDMのポイント】TDMの対象にはならない

【薬物動態】血漿および脳脊髄液濃度は1週間で定常状態に達する (11)

【OW係数】2.9 (11) 【pKa】9.0, 10.0 (1)

【相互作用】メトクロプラミド，チアプリド，フェノチアジン等との併用時には錐体外路症状の発現に注意 (1)

【禁忌】パーキンソン病，レビー小体型認知症患者，褐色細胞腫の疑いのある患者に禁忌 (1)

【更新日】20241003

※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。