

○ピレチア錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】プロメタジン塩酸塩 (U) Promethazine Hydrochloride 【分類】抗ヒスタミン・抗パーキンソン剤

【単位】▼5mg・○25mg錠

【常用量】1回5～25mg (振戦麻痺・パーキンソンニズムには1日25～200mgを適宜分割)

【用法】分1～3

【透析患者への投与方法】常用量 (3,12)

【保存期CKD患者への投与方法】常用量 (3,12)

フェノチアジンの高用量投与は注意 (McAllister CJ, et al: Clin Nephrol 1978 PMID: 729214)

【特徴】ヒスタミンH1受容体で、中枢抑制作用(鎮静、催眠、鎮痛など)、鎮痙作用、抗コリン作用も有する。この強い抗コリン作用は、パーキンソンニズム治療に利用される。作用時間が長く、鎮静・催眠作用が強いので夜間掻痒などのため眠れない症例に適する。

【主な副作用・毒性】光過敏症、肝機能障害、白血球減少、顆粒球減少、耳鳴、視覚障害、けいれん、血圧上昇、起立性低血圧、振戦、咳嗽、悪性症候群など

【安全性に関する情報】中枢抑制作用が強い。(Ridout F, et al: Ann Allergy Asthma Immunol 2003 PMID: 12722962)

【吸収】消化管からの吸収率は80%以上だが、初回通過効果が著しい(1)

【F】25% (10) 初回通過効果を受ける(1) 12.3～40% (Koytchev R, et al: Arzneimittelforschung 1994 PMID: 8147942)

【tmax】2～3hr (1)

【代謝】CYP2D6によって代謝(水酸化)される(9) 肝臓で主にプロメタジンスルホキシド、デスメチルプロメタジンに代謝される。尿中には主として未変化のプロメタジンとプロメタジンスルホキシドが排泄される(1) UGT1A4, UGT2B10によるN-グルクロン酸抱合が三級アミン代謝に関与(Lu D, et al: J Pharm Biomed Anal 2017 PMID: 28803208)

【排泄】尿中未変化体排泄率0.6% [po, 72hrまで] (1,11) プロメタジンスルホキシドとして尿中に10.3%回収 [po, 72hrまで] (1,11) 低い(12) 主な排泄経路は胆汁排泄(11)

尿中代謝物としてスルホキシド、脱メチル体、脱メチル体スルホキシドが同定 (Song Q, et al: J Chromatogr B Biomed Sci Appl 2001 PMID: 11710587)

【CL】1133mL/min (10)

【t1/2】12hr (10) 7～14hr (U,11) 16～19hr (Strenkoski-Nix LC, et al: Am J Health Syst Pharm 2000 PMID: 10965395)

【蛋白結合率】76～93% (1,11) 93% (12) 65～90% (U)

【Vd】13.4L/kg (1) 13L/kg (10) 【分布】広く分布する。脳内濃度は血漿濃度より高いものの、他の臓器に比し低い(11)

【MW】320.88

【透析性】Vdが非常に大きいため、効率的には除去できないと考えられる(5)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない【O/W係数】320 [1-オクタノール水系, pH7] (1) 【pKa】9.75 (1)

【効果発現時間】15～60分(1) (錠) tmaxは2～3hrであるが治療効果は15～30分で得られる(11)

【効果持続時間】抗ヒスタミン作用: 4～12時間(1) (錠)

【禁忌】昏睡状態の患者、緑内障患者、前立腺肥大症患者、中枢神経抑制剤の強い影響下にある患者には投与禁忌

【更新日】20240930

※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。