

△コントミン糖衣錠 [内], ▼コントミン注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 クロルプロマジン塩酸塩 (U) chlorpromazine hydrochloride 【分類】 精神神経用剤 [フェノチアジン]

【単位】 △12.5mg/錠, ▼25mg/A [5mL]

【常用量】 ■内服：30～100mg/日, 精神科領域 50～450mg/日 ■筋注：1回 10～50mg

【用法】 ■内服：分1～3 ■注射：緩徐に筋注

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3,4,10)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10,12)

【その他の報告】 腎機能障害患者ではフェノチアジンにより重度の低血圧が発現しやすい可能性がある (U)

【特徴】 脳内 DA のシナプス効果を減らし抗精神病効果を発揮する。錐体外路症状を起こしやすい。延髄 CTZ を抑制し制吐作用を示す。交感神経遮断作用あり。心臓・血管平滑筋に対し直接抑制する。局所麻酔作用もある。

【主な副作用・毒性】 血圧低下, 血球減少, 麻痺性イレウス, 遅発性ジスキネジア, 錐体外路症状, 肝障害, 悪性症候群, SIADH, 不眠, 錯乱, SLE, 光線過敏症, アカンジア, 痙攣, 月経不順, 便秘など。

【安全性に関する情報】 長期投与で眼に沈着 (Razeghinejad MR, et al: Clin Experiment Ophthalmol 36: 560-3, 2008)

【モニターすべき項目】 異常行動, 血算と咽頭痛や熱や感染をとともなう患者の変化, 血圧測定, 遅発性ジスキネジアの早期兆候の注意深い観察, 肝機能測定と尿中ビリルビン, 眼科, 血清濃度 (U)

【吸収】 96% (11)

【F】 32% [対 im] (1,10,13,14) 反復投与で低下 [初回通過効果の変化による] (Dahl SG, et al: Clin Pharmacol Ther 21: 437-48, 1977) 4～38% (Yeung PK, et al: Eur J Clin Pharmacol 45: 563-9, 1993)

【tmax】 3～4hr (1) 1～4hr (13) 【Cmax】 100mg を 1 日 2 回, 33 日間経口投与したとき 25～150ng/mL (13)

【代謝】 肝代謝 (U) CYP2D6 で代謝され代謝物 N-オキシド体および脱メチルスルホキシド体は未変化体と同等の活性を持つ (1) 7-OH 体も活性を有する (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 1%以下 (13) 5% (10) 1% (14)

【CL】 内服: 633mL/min (16) 65.8～83.5L/hr (1) 8.6mL/min/kg (13) 41.5～83.5L/hr [iv] (1) 76.6L/hr で個人差は比較的小さい (Yeung PK, et al: Eur J Clin Pharmacol 45: 563-9, 1993) 喫煙者で上昇 (Chetty M, et al: Eur J Clin Pharmacol 46: 523-6, 1994) 【非腎 CL/総 CL】 100% (10)

【t1/2】 15～59hr [平均 30hr] (2) 16～30hr (4,10) 30hr (8) 8～35hr (11) 11～42hr (12) 30hr (13,14) N-オキシド体 6.7hr (1) 【透析患者の t1/2】 16～30hr (4,10) 腎機能正常者と同じ (12)

【蛋白結合率】 98% (2,10) 92～96% (6) 95～98% (1,8,13) 91～99% (1,12) 90%以上 (U)

【Vd】 21L/kg (1,3,13,14) 7.4L/kg (6) 7L/kg [注] (11) 8～160L/kg (12)

【MW】 561.09

【透析性】 蛋白結合率が高く分布容積も大きいので、透析によってほとんど除去されないとされる (5) DHP では除去できる (1)

【TDM のポイント】 統合失調症での有効治療域 30～350ng/mL (1) 40～350ng/mL (16) 50～300ng/mL (14) 振戦・痙攣などの神経毒性は 750～1000ng/mL で起こる (13) 750ng/mL 以上で中毒症状 (1)

【薬物動態】 血中濃度の個人差の主な原因は初回通過効果の程度によると思われる (Yeung PK, et al: Eur J Clin Pharmacol 45: 563-9, 1993)

【O/W 係数】 2500 (11) 134896 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】 9.3 (1)

【相互作用】 アドレナリンの血圧反転 (1) ドパミン作動薬の作用減弱 (1) CYP2D6 の EM 患者ではキニジンにより 7-水酸化が阻害 (Muralidharan G, et al: Eur J Clin Pharmacol 50: 121-8, 1996)

【効果発現時間】 鎮静・催眠作用は投与後 2 時間以内 (1) 抗精神病作用；徐々に (数週間まで) そして患者間差ある (U)

【最大効果発現時間】 抗精神病作用；血漿濃度が定常状態に達するのに 4～5 日かかり、最大治療効果が 6 週～6 ヶ月であられる (U)

【更新日】 20180709

※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。