

○グラマリール錠 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】チアプリド塩酸塩 Tiapride Hydrochloride 【分類】ベンズアミド系抗ドパミン剤

【単位】○25mg・▼50mg/錠

【常用量】75～150mg/日

【用法】1日3回

【透析患者への投与方法】半減期が約5倍に延長するため25mg/日を基準に最大50mg/日(5)

【その他の報告】興奮状態からの改善目的に、2日間25～75mg/日を使用し、3日以降は25mg/日、維持量は12.5mg/日として副作用を回避(島 祐子, 第16回日本医療薬学会年会講演要旨集 p385,2006)

【保存期 CKD 患者への投与方法】半減期が2～5倍に延長するため常用量の50%以下に減量(5)

【特徴】D2-blocker. スルピリドより脳内移行性が高い。自律神経抑制作用、血圧下降、心抑制、平滑筋運動抑制作用はクロルプロマジン[®]の1/10～1/100(1)

D2, D3 受容体に親和性があるが, D1, D4, H1, AURFA1, α_2 , 5-HT などの受容体には親和性がない (Scatton B, et al: Eur Psychiatry 2001 PMID: 11520476)

【主な副作用・毒性】悪性症候群, めまい, ふらつき, 口渇, 不眠, パーキンソン症候群, 振戦, 流涎, 痙攣, 昏睡, 女性化乳房, 消化器症状, 肝障害, 血中プロラクチン上昇など

【F】ほぼ完全に吸収(1) 筋注もしくは経口で49.3～98.9% (Rey E, et al: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 20: 62-7, 1982)

【Tmax】2hr(1) 1.4hr (Roos RA, et al: Eur J Clin Pharmacol 31: 191-4, 1986)

【代謝】ほとんど代謝されない(1) 尿中の代謝物は脱エチル化体(1) CYPに影響しない(1)

【排泄】尿中未変化体排泄率71.7% [po, 24hr まで](1) 75.6% (Rey E, et al: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 20: 62-7, 1982) 約50% (Roos RA, et al: Eur J Clin Pharmacol 31: 191-4, 1986) 51% [po, 24hr まで] (Norman T, et al: Eur J Clin Pharmacol 32: 583-6, 1987) 尿中にN-脱エチル体として9.3%回収 [24hr まで](1)

【CL】腎 CL18L/hr(1) 11.8～24.9L/hr (Rey E, et al: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 20: 62-7, 1982) 16.6L/hr (Norman T, et al: Eur J Clin Pharmacol 32: 583-6, 1987)

【半減期】腎機能正常 4.13hr, Ccr 61～80mL/min : 4.24hr, Ccr 31～60mL/min : 7.54hr, Ccr 11～30mL/min : 8.63hr, Ccr 10mL/min 未満 : 21.6hr(1) 平均3.23hr [範囲 2.19～4.55hr] (Rey E, et al: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 20: 62-7, 1982) 5.3hr (Norman T, et al: Eur J Clin Pharmacol 32: 583-6, 1987) 平均229分 (Roos RA, et al: Eur J Clin Pharmacol 1986 PMID: 2948825)

【蛋白結合率】10%以下(1) 結合しない (Roos RA, et al: Eur J Clin Pharmacol 31: 191-4, 1986)

【Vd】0.6～0.8L/kg(1)

【MW】364.89

【透析性】4～20%程度が透析で回収される [筋注後4時間からHD実施時の回収率](1)

【OW係数】0.0343 [1-オクタノール/水系, pH7.0](1)

【主な臨床報告】カルバマゼピンと併用でアルコール離脱症候群の治療に適用されることがある (Latifi S, et al: Pharmacopsychiatry. 2019 PMID: 30522144)

老人性認知症の行動・精神症状に対してリスペリドンより有効 (Yuan Y, et al: Eur Rev Med Pharmacol Sci 2016 PMID: 27460743)

コリンエステラーゼに対する保護作用がある (Petroianu GA, et al: J Appl Toxicol 2005 PMID: 16193528)

【更新日】20221110

※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。