

▼カバサル錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】カベルゴリン (U) cabergoline 【分類】ドパミン作動薬

【単位】▼0.25mg・▼1mg/錠

【常用量】■パーキンソン病：0.25mg/日より開始し、2週目に0.5mg/日とし、以後経過を観察しながら1週間毎に1日量として0.5mgずつ増量し、最高1日3mg

■乳汁漏出症・高プロラクチン血症性閉経障害・高プロラクチン血症下垂体腺腫：1週1回(同一曜日)就寝前に0.25mg/日から開始し、以後臨床症状を観察しながら、少なくとも2週間以上の間隔で1回量を0.25mgずつ増量し、維持量(0.25~0.75mg/日)とする[最大1回1mg]

■産褥性乳汁分泌抑制：1mgを胎児娩出後に1回のみ食後

■生殖補助医療に伴う卵巣過剰刺激症候群の発症抑制：1日1回0.5mgを最終的な卵胞成熟の誘発日又は採卵日から7~8日間、就寝前に投与

【用法】■パーキンソン病：1日1回朝食後■その他：添付文書参照

【透析患者への投与方法】肝代謝型薬物のため減量の必要はないと思われる(5)

【保存期CKD患者への投与方法】肝代謝型薬物のため減量の必要はないと思われる(5)

【特徴】麦角アルカロイド誘導体で持続的なドパミンD2受容体刺激作用を有する。中枢神経系に対しては、黒質線条体のD2受容体に作用し抗パーキンソン作用を示す。内分泌系に対しては、下垂体前葉のD2受容体に作用しプロラクチン分泌を特異的に抑制(抗プロラクチン作用)。パーキンソン病治療において、非麦角製剤の治療効果が不十分又は忍容性に問題があると考えられる患者のみに投与。

【主な副作用・毒性】消化器症状(悪心、嘔吐、便秘など)、頭痛、めまい、ふらつき、幻覚、妄想、失神、せん妄、錯乱、悪性症候群、間質性肺炎、胸水、胸膜炎又は肺線維性変化、心膜炎、心臓弁膜症、肝機能障害、狭心症など

【吸収】主な吸収部位は腸管。吸収率約52%。少なくとも17.3%が消化管から再吸収を受けることが推測[ラット](1)

【F】初回通過効果を受けるが正確なFは不明(U)

【tmax】1.9hr(1)

【代謝】脱メチル体の生成にはCYP3A4が関与(1)他にCYP2C18, 2D6の関与が示唆(1)加水分解によって不活性代謝物になり、P450による代謝はマイナーでかつ誘導や阻害もしない(U)脱メチル体には未変化体と同等の活性がある(1)

【排泄】尿中未変化体排泄率1.3% [po, 168hrまで](1)4%(U)尿中に22%、糞中に60%回収(U)

【CL/F】11.7±7.9L/hr/kg, 腎機能障害患者：15.4~47.0mL/min(1)非腎CL：3.2L/min、腎CL：0.08L/min(U)【腎CL】76.7±45.9mL/minで全身CLに対する寄与は小さい(1)

【t1/2】43hr(1)63~69hr(U)62~91hr(11)【Kel】0.0251±0.0174/hr(1)

【蛋白結合率】59.3~65.5%(1)40~42%(U)41~42%(11)

【Vd/F】少なくとも100L/kgと大きい(U)資料なし(1)

【MW】451.60

【透析性】透析性は低いと思われる(5)資料なし(1)

【O/W係数】LogP=14.4 [1-オクタノール/buffer, pH7](1)【pKa】8.9

【相互作用】CYP3A4阻害剤や誘導剤との併用に注意する(1)降圧剤の作用増強(1)抗ドパミン薬と作用拮抗(1)

【備考】心臓弁逆流の発症に関連する(Zanettini R, et al: N Engl J Med 356: 39-46,2007) Restless legs syndromeの治療に有用との報告(Aizawa H, et al: Intern Med 45:453-5, 2006)があるが、心臓弁膜症の発症リスクがあるため非麦角系薬を選択すべきと思われる(5)本剤2mgはレボドパ100mgに相当(村田美穂: Medical Practice 26: 2071-6, 2009)

【更新日】20230112

※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。