

△ルーラン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ペロスピロン塩酸塩水和物 Perospirone Hydrochloride Hydrate 【分類】 非定型抗精神病薬 [SDA]

【単位】 △4mg・▼8mg・▼16mg/錠

【常用量】 12mg/日より開始し、徐々に増量し維持量は12～48mg/日

【用法】 1日3回・食後 [空腹時投与では吸収率が低下]

【透析患者への投与方法】 設定されていない (1) 低用量より開始 (5)

【その他の報告】 糖尿病を伴うHD患者の譫妄治療に有効であった2例 (大内雄太, 他: 透析会誌 46: 481-6, 2013)

【保存期CKD患者への投与方法】 腎不全ラットでAUCが2倍に上昇するため慎重投与 (1)

【その他の報告】 低用量より開始 (5)

【特徴】 ハロペリドールよりD2遮断作用は弱い、5-HT₂遮断作用は強力で、錐体外路系障害は軽度。高プロラクチン血症も少ない。抗不安作用はあるが、陽性症状に対する作用は比較的弱い。

【主な副作用・毒性】 悪性症候群、ジスキネジア、麻痺性イレウス、SIADH、横紋筋融解症、白血球減少、高血糖、錐体外路障害 (アカシジア、振せん、構音障害など)、不眠、眠気、血中プロラクチン上昇など

【吸収】 食事によりAUCが2.4倍増大 (1)

【F】 90% [サル] (1)

【t_{max}】 0.8hr (Yasui-Furukori N, et al: Ther Drug Monit 26: 361-5, 2004) 0.5～4hr (1)

【代謝】 CYP3A4で代謝される (1) 活性代謝物は水酸化体で未変化体よりも薬効への寄与が大きい可能性がある (Yasui-Furukori N, et al: Ther Drug Monit 26: 361-5, 2004) 主代謝物の抗セロトニン作用は未変化体の1/8で抗ドパミン作用はほとんど認められない [ラット] (1) 主にCYP3A4で代謝され、1A1, 2C8, 2D6, 3A4も関与 (Mizuno Y, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 2003 PMID: 14503666)

主代謝物のID15036には活性があり、血中濃度も高く、プロラクチン濃度とも正相関している (Suzuki Y, et al: Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry 2010 PMID: 20363276)

【排泄】 尿中未変化体排泄率0.3～0.4% (1) 尿中には主に1-水酸化ペロスピロンとして排泄される (1) 尿中回収率40% [サル] (1) 胆汁中に40%排泄されるが、6%が腸肝循環する [ラット] (1)

【t_{1/2}】 β相5～8hr (1)

【蛋白結合率】 96～97% (1)

【V_d】 組織移行性が高い (1)

【MW】 499.07

【透析性】 データなし (1) 透析されないとされる (5)

【O/W係数】 有機相に分配 (1)

【相互作用】 CYP3A4阻害剤により代謝阻害 (Masui T, et al: Ther Drug Monit 2006 PMID: 16418697) カルバマゼピン [CYP3A4誘導剤] 併用により未変化体および活性代謝物の血中濃度が低下 (Masui T, et al: Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry 2006 PMID: 16600452) ジゴキシンの血中濃度上昇の可能性 (5) ケトコナゾール併用でクリアランス低下 (Shimakura J, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 2003 PMID: 14503667)

【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。