

## ○パーロデル錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 プロモクリプチンメシル酸塩 (U) bromocriptine mesilate 【分類】 持続性ドパミン作動薬

【単位】 0.25mg/錠

【常用量】 ■パーキンソン症候群: 1.25~2.5mg/日 (分1 朝食直後) から開始, 1~2 週毎に2.5mg/日ずつ増量して, 維持量15~22.5mg/日 ■高プロラクチン血症: 2.5mg/日 [夕食直後] から開始し, 5~7.5mg/日で維持 ■末端肥大症・下垂体性巨人症: 2.5~7.5mg/日

【用法】 分1~3 (食直後)

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (3,4)

【その他の報告】 1/2 錠を隔日投与すると半数の透析患者で FSH, LH、テストステロンの上昇とともにインポテンツの改善が見られる (Am J Kidney Dis 6: 111-8, 1985) 3.5~7.5mg/日を透析患者に投与すると 17 例中 7 例にテストステロン濃度の上昇とともにインポテンツの改善が見られたが、FSH、LH には差がなかった (J Andol 6: 113-6, 1985) 高プロラクチン濃度の透析患者に 1 錠/日投与すると平均血圧が有意に低下し、血清プロラクチン、血漿ノルエピネフリンが低下する (Clin Sci 69: 51-6, 1985)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (3,10)

【特徴】 ドパミン受容体に直接作用する。レボドパと併用により、レボドパの減量可能 (それにより副作用軽減)。不随意運動・症状の日内変動の発現を減少。しかしレボドパを十分量用いた時ほど初期から大きな効果は期待しにくい。D2 受容体刺激作用と D1 受容体拮抗作用を有している。5-HT2A や 2B 受容体には比較的高い親和性を有し、2B 受容体には部分アゴニスト作用を持っている。カベルゴリンよりもジスキネジアの発現頻度が有意に低い。

【主な副作用・毒性】 悪心・嘔吐、めまい、血圧低下、躁状態、幻覚、鬱状態、不安、錯乱などの精神症状 (1 日 5mg 程度でも起こることがある)、悪性症候群、心臓弁膜症など

【モニターすべき項目】 血圧、トルコ鞍の画像診断、妊娠検査、血清プロラクチン、視野検査 (末端肥大症には成長ホルモン、身体計測)

【吸収】 30~40% (11)

【F】 6% [吸収率は28%だが、初回通過効果のため循環血中には6%のみが移行] (U,10) 3~6% (13) 7% (1)

【tmax】 1~3hr (U) 1.6hr, 食物と同時に摂取で延長 (13) 【Cmax】 5mg 経口投与時 691pg/mL (13)

【代謝】 肝で代謝 (U) CYP3A4 で代謝される (1) CYP3A4 の阻害剤でもある (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 2% (10) 6~7% (10) 代謝物として胆汁中に 95% 排泄、腎排泄は 2.5~5.5% (U)

【CL】 933mL/min (10) 5mL/min/kg (13) 【非腎 CL/総 CL】 100% (10)

【t1/2】  $\alpha$  相 6.5hr ;  $\beta$  相 67.9hr (1)  $\alpha$  相 4~4.5hr ;  $\beta$  相 15hr (U) 3hr (10) 15hr (11) 7hr (13)

【蛋白結合率】 90% (10) 90~96%, 血漿アルブミンと結合 (U) 93% (13)

【Vd】 3.4L/kg (10) 1~3.7L/kg (11) 2L/kg (13)

【MW】 750.8 (遊離体 654.6)

【透析性】 蛋白結合率が高いため、透析では除去されにくいと思われる (5)

【TDM のポイント】 TDM の対象にはならない 【O/W 係数】 235 (11) 【pKa】 4.86 (1)

【相互作用】 CYP3A4 で代謝されたこれを阻害するので注意 (1) フェノチアジン系薬物はドパミン受容体遮断作用を持つため本剤と薬理的拮抗を示す (1) エリスロマイシンが OATP-C による取り込みを阻害して PK を変化させる (Lu WJ, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 421, 2006 [Letter])

【効果発現時間】 血清プロラクチン低下作用: 2hr、抗パ作用: 30~90min、成長ホルモン低下作用: 1~2min 【最大効果発現時間】 血清プロラクチン低下作用: 8hr (単回投与)、4 週間 (持続投与)。抗パ作用: 2hr (単回投与)。成長ホルモン低下作用: 4~8 週間で臨床効果発現

【効果持続時間】 血清プロラクチン低下作用 (投与中止 2 カ月後に血清プロラクチン濃度が治療前値に戻る): 24hr (単回投与)、抗パ作用: 30~90min、成長ホルモン低下作用: 4~8hr

【備考】 本剤 10mg はレボドパ 100mg に相当 (村田美徳: Medical Practice 26: 2071-6, 2009)

【更新日】 20180416

※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。