

▼ヒスロン錠・▼H錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】メドロキシプロゲステロン酢酸エステル (U) medroxyprogesterone 【分類】黄体ホルモン製剤

【単位】▼5mg/錠, ▼200mg/H錠

【常用量】■無月経, 月経周期異常, 月経量異常, 機能性子宮出血, 黄体機能不全による不妊症, 切迫流産, 習慣性流産: 2.5~15mg/日 ■乳癌: 600~1200mg/日 ■子宮体癌 (内膜癌): 400~600mg/日

【用法】分1~3 ■乳癌: 分3 ■子宮体癌: 分2~3

【透析患者への投与方法】透析患者の投与方法に言及した文献なし (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】腎不全患者の投与方法に言及した文献なし (5)

【特徴】合成黄体ホルモンの一種で, 子宮内膜に対する作用及び妊娠維持作用は強力で, 排卵抑制作用も有するが体温上昇作用は弱い。黄体ホルモン作用の他に抗エストロゲン, 抗ゴナドトロピン作用を有する。

【主な副作用・毒性】血栓症, CHF, アナフィラキシー, 乳頭水腫 [視力消失, 眼球突出, 複視, 片頭痛], 月経異常, 多毛, 脱毛, 白血球増多, 耐糖能異常, しびれ, 筋痙攣, 眠気, 神経過敏, 浮腫, 高Ca血症, 血圧上昇, 頻脈など

【安全性に関する情報】動・静脈血栓症に関連する可能性があり, 投与前, 投与中定期的に FDP, $\alpha 2$ プラスミンインヒビター・プラスミン複合体等の検査を行う (1) 長期間大量連用で副腎皮質ホルモン様作用があらわれることがある (1)

【モニターすべき項目】胸部検査, Papanicolaou (PAP) test, 身体検査

【吸収】100% (11)

【F】10%以下 (13) 肝での初回通過効果はない (U)

【tmax】低用量 2hr 以内, 高用量 3.4hr (13) 【Cmax】10mg 経口投与時 4.2~6.3nM, 500mg 経口投与時 123nM (13)

【代謝】肝で CYP3A4 によって代謝 [6 β -水酸化] される (9) 肝代謝を受ける (1)

【排泄】腎 15~22%, 糞便中 45~80% (1,U) 【CL】1267mL/min (10) 153mL/min/kg (13) 【非腎 CL/総 CL】55% (10)

【t1/2】30hr (U,11) ~36hr (10) 30.1hr (13) 50~60hr (1)

【蛋白結合率】94% (10,11) 90%以上 (U) 92%以上 (1)

【Vd】0.6L/kg (10) 20L/man (11)

【MW】386.52

【透析性】蛋白結合率が高いため, 透析で除去されにくいと思われる (5) 資料なし (1)

【TDM のポイント】有効治療域に統一された見解はないが, 40~100ng/mL 以上との報告がある (1) 患者間の PK パラメータの変動が大きく, 経口投与量と Cmax は相関しない (Cancer Chemother Pharmacol 42: 1-8, 1998) 1000mg 投与時の Cmax は 10~269ng/mL [平均 51ng/mL] と幅広い。副作用が起こった血中濃度は平均 81ng/mL であり, 50~70ng/mL が有効治療域となる (Bull Cancer 80: 431-8, 1993) 【O/W 係数】1600 (11) 資料なし (1)

【相互作用】血栓症のリスクのため黄体ホルモン, 卵胞ホルモン, 副腎皮質ホルモン等との併用禁忌 (1)

【更新日】20150728

※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。