

◎メジコン錠・△散・◎配合シロップ [内]

【重要度】 【一般製剤名】デキストロメトルファン臭化水素酸塩 (U) Dextromethorphan Hydrobromide Hydrate 【分類】中枢性鎮咳剤

【単位】◎15mg/錠, △散 10%, ◎シロップ 2.5mg/mL

【常用量】15mg~120mg/日

【用法】分1~4

【透析患者への投与方法】50%に減量 [45mg/日で使用] (5) するが、短期ならこの限りではない (5) 【PD】30mg/日投与時にミオクローヌスを発現した症例あり [メトプロロール併用例] (Tanaka A, et al: Ann Pharmacother 45: e1, 2011)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Ccr>50mL/min : 減量の必要なし, Ccr 10~50mL/min : 75%に減量, Ccr<10mL/min : 50%に減量 (5)

【特徴】リン酸コデインに匹敵する強力な鎮咳剤。右旋性で非麻薬性のため習慣性・依存性はないが、リン酸コデインのような気道分泌抑制作用もない。延髄の咳中枢を直接抑制し、非湿性の咳に用いる。

【主な副作用・毒性】呼吸抑制, アナフィラキシー, 頻脈, 動悸, 眠気, 頭痛, めまい, 食欲不振, 便秘, 腹痛, 口渇, 構音障害など

【吸収】良好 (11) 【Ka】0.77~1.155/hr (1)

【F】資料なし (1) 75% (14) 初回通過効果を受けるため小さい (11) 腎不全患者ではFが上昇する (Evans WE, ed: Applied Pharmacokinetics 3rd ed p8-1-8-49)

【tmax】2~2.5hr (1,13) 【Cmax】60mg 単回経口投与後時, CYP2D6 の EM 5.2ng/mL, CYP2D6 の PM 33ng/mL (13)

【代謝】肝の CYP2D6 で急速に代謝され、主要活性代謝物の O-脱メチル体の dextrorphan になる。また CYP3A4 によって N-脱メチル体になる。O-脱メチル体、N-脱メチル体および N, O-脱メチル体はいずれも dextromethorphan と同様の鎮咳作用を示す。これらはさらにグルクロン酸抱合される (12) CYP2D6 により O-脱メチル化, CYP3A4 により N-脱メチル化される (1) Dextrorphan, (+)-3-Hydroxy-N-methylmorphinan, (+)-3-Methoxy-N-methylmorphinan, (+)-3-Hydroxymorphinan には未変化体と同等の活性がある (1) クレゾールスルホン酸カリウムの主代謝物は、4-クレゾールスルホン酸 (1)

【排泄】主に腎から未変化体, dextrorphan を含む脱メチル化合物として排泄 (U) 活性代謝物の dextrorphan は 47.5% (24.1~72.1%) が尿中に排泄されるが、腎不全では dextrorphan の尿中排泄率は 24.4% (9.7~55.9%) に低下する (Clin Pharmacol Ther 59: 583-92,1996) 尿中未変化体排泄率 20% (14) CYP2D6 の EM : 0.19%, CYP2D6 の PM : 11.1% (13) 【CL】CYP2D6 の EM : 1575mL/min/kg, CYP2D6 の PM : 3.9mL/min/kg 以下 (13) 未変化体として 52004~94492mL/hr/kg (1) デキストロメトルファンとして 230mL/hr/kg (1)

【t1/2】2.7~3.3hr (1) dextromethorphan : CYP2D6 の EM 3.4hr, CYP2D6 の PM 29.5hr (13) 3.2hr (1) 2.7hr (14) 29.5hr (J Clin Psychopharmacol 15: 263-9,1995) dextrorphan : 2.7hr (1) dextrorphan : 3~4hr (1) 【Ke】0.24±0.107/hr (1)

【蛋白結合率】資料なし (1) 58.7% (Tanaka A, et al: Ann Pharmacother 45:e1, 2011)

【Vd】1.1L/kg (14) 資料なし (1)

【MW】370.32

【透析性】データなし (1)

【TDM のポイント】有効治療域 200~350ng/mL (14) TDM の対象にならない 【O/W 係数】3.7 (11) 16.98 [1-オクタノール/buffer, pH7] (1)

【相互作用】CYP2D6 を阻害する薬剤との相互作用に注意 (1) CYP2D6 の EM ではシナカルセトとの併用によりデキストロメトルファンの AUC が 11 倍, Cmax が 7 倍上昇 (Nakashima D, et al: J Clin Pharmacol 47: 1311-9, 2007) MAO 阻害剤 : セロトニン症候群のおそれがあり禁忌 (1)

【効果発現時間】通常 1hr 以内

【効果持続時間】6hr まで

【備考】配合シロップには 1mL 中デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物 2.5mg, クレゾールスルホン酸カリウム 15mg 含有 (1)

【更新日】20230620

※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。