

◎ジヒドロコデインリン酸塩散 1% [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】ジヒドロコデインリン酸塩 dihydrocodeine phosphate 【分類】麻薬性鎮咳剤

【単位】◎1%散 [10mg/g]

【常用量】3g (30mg) /日

【用法】分3, または頓用

【透析患者への投与方法】腎不全では昏睡時間が延長するという報告あり (BMJ 286: 439-439,1983, BMJ 287: 751-752,1984) 通常の投与量でも急性腎不全患者で重篤な昏睡が発現したという症例報告 (Eur J Anaesthesiol 6: 303-314,1989) t1/2は変わらないもののCmaxやAUCは上昇する (BMJ 290: 740-742,1985) ため、バイオアベイラビリティの上昇が全身クリアランスの低下があるものと考えられる。便秘が悪化しやすいこともあり、長期投与時には正常者より少なめがよいであろう (5)

【その他の報告】50%に減量 (3)

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

【特徴】延髄の咳嗽中枢を抑制することにより鎮咳作用を現わす。リン酸コデインよりも鎮咳作用は強い。中枢性の鎮痛作用はモルヒネの1/3、コデインの2倍。

【主な副作用・毒性】依存性、呼吸抑制、錯乱、せん妄、気管支痙攣、咽頭浮腫、麻痺性イレウス、不整脈、めまい、眠気、悪心・嘔吐、便秘など

【吸収】95~100% (11)

【F】21% (1,14) 初回通過効果を受ける (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】1.2~1.5hr (1)

【代謝】CYP2D6で代謝。脱メチル化体、グルクロン酸抱合体になる (Clin Pharmacokinetics 31: 410-422,1996) ジヒドロコデインからジヒドロモルヒネへのO-脱メチル化はCYP2D6で、ジヒドロコデインからノルジヒドロコデインへのN-脱メチル化は主としてCYP3Aにより触媒 (1) 主としてUGT2B7, UGT2B4および一部CYP3A4, CYP2D6で代謝 (1) CYP2D6のultra-rapid metabolizerでは活性代謝物のジヒドロモルヒネの血中濃度が上昇して副作用が発現しやすくなるおそれ (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率10% (14) 尿中回収率90% (1) 【CL/F】43L/hr (1)

【t1/2】4~5hr (1) 3.4~4.5hr (11) 6hr (14) 【透析患者のt1/2】健常者と同じ (BMJ 290: 740-740,1985)

【蛋白結合率】データなし (1)

【Vd】1.1L/kg (11) 3.5L/kg (14) 203L/man (1)

【MW】399.38

【透析性】効率的には除去されないと思われる (5)

【TDMのポイント】有効治療域50~250ng/mL (14) 中毒濃度約1μg/mL, 血中致死レベル: 0.8~12μg/mL (1) 通常、TDMの対象にはならない、【OW係数】1.5 (11)

【更新日】20171218

※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。