◎ロペミンカプセル・▼細粒　［内］

【重要度】　【一般製剤名】ロペラミド塩酸塩（U）　Loperamide Hydrochloride　【分類】止瀉剤
【単位】◎1mg/Cap，▼細粒 0.1%
【常用量】1～2mg/日
【用法】分 1～2
【透析患者への投与方法】減量の必要なし（5）
【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし（5）
【特徴】作用は強力で血液脳関門を通過しないため中枢作用はなく安全性が高い．内因性のアセチルコリンを阻害することにより腸管の蠕動を抑制する．抗分泌（水，電解質の腸管腔内貯留抑制），蠕動抑制の両面から止瀉作用を示す．高用量では胃酸分泌を阻害する（U）
【主な副作用・毒性】過敏症，腹部膨満感，腹部不快感，悪心，腹痛，まれに嘔吐，食欲不振など
【安全性に関する情報】過量投与により QT 延長，心室性不整脈，昏睡，呼吸抑制，尿閉など（1）
【吸収】吸収されにくい（U）65%以上（11）
【tmax】5hr（U）
【代謝】肝（U）CYP3A4 および CYP2C8 で代謝（1）肝代謝によりロペラミドの N-ジメチルアミド基の脱メチル化で，ノデスメチルロペラミド（弱い活性あり）及びジデスメチルロペラミド（弱い活性あり）を生成する．ヒトの糞中にはモノデスメチルロペラミド及び未変化体，次いでジデスメチルロペラミドが多い（1）尿中にはモノデスメチルロペラミドが多く，次いでジデスメチルロペラミド及び未変化体が認められ，グルクロン酸抱合体は相対的に少ない（1）
【排泄】糞便中及び腎（U）尿中未変化体排泄率 1%（1,J Clin Pharmacokinet 19: 211-8,1979）P-gp の基質（Sadeque AJM, et al: Clin Pharmacol Ther 68: 266-73, 2000）
【非腎 CL/総 CL】100%（10）
【t1/2】10.8（9.1～14.4）hr（1）9.1～14.4hr（U）10～12hr（11）11.2hr（J Clin Pharmacokinet 19: 211-8,1979）
【蛋白結合率】97%（U）96.5%（1）
【Vd】データなし（1）おそらく大きい（5）
【MW】513.5
【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（10）資料なし（1）
【TDM のポイント】TDM の対象にはならない【O/W 係数】高い（11）26.7（クロロホルム系/pH7）（1）【pKa】8.7（1）
【相互作用】ケイ酸アルミニウム，タンニン酸アルブミンとの併用により本剤が吸着して効果が減弱するおそれがあるので投与間隔をあけるなど注意（1）P-gp 阻害剤との併用で中枢移行性が高まり呼吸抑制が出現したとの報告があるが，通常用量では問題とならないと思われる（Clin Pharmacol Ther 68 :231-7, 2000）P-gp 阻害薬であるキニジン併用によりオピオイド作用である呼吸抑制が認められる（Sadeque AJM, et al: Clin Pharmacol Ther 68: 266-73, 2000）CYP3A4 または CYP2C8 を阻害する薬剤と併用した際，代謝が阻害され血中濃度が上昇する可能性がある（1）P-pg の基質（1）リトナビル併用で AUC が 2.6 倍に上昇するが，中枢性の毒性には関連しない可能性（Tayrouz Y, et al: Clin Pharmacol Ther 70: 405-14, 2001 PMID: 11719726）

【効果持続時間】24 時間以内
【備考】抗生物質の投与に伴う偽膜性大腸炎の患者，出血性大腸炎の患者などの重篤な感染性下痢患者では，症状の悪化，治療期間の延長をきたすおそれがあるため禁忌（1）感染性下痢患者には原則禁忌（1）
【更新日】20220922

※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。