

◎ドプス OD錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ドロキシドパ droxidopa 【分類】ノルエピネフリン作動性神経機能改善薬

【単位】◎100mg・▼200mg/OD錠

【常用量】■起立性低血圧を伴うHD患者におけるめまい・ふらつき・たちくらみ、倦怠感、脱力感の改善：1回量200～400mg [最大400mg]

■パーキンソン病 (Yahr 重症度ステージIII) におけるすくみ足、たちくらみの改善：1日100mgで開始、隔日に100mgずつ増量し最適量を決定。標準維持量600mg [最大900mg]

■シャイドレーガー症候群、家族性アミロイドポリニューロパチーにおける起立性低血圧、失神、たちくらみの改善：1日200～300mgで開始、数日から1週間毎に100mgずつ増量、標準維持量300～600mg [最大900mg]

【用法】■起立性低血圧を伴うHD患者：HD開始30分～1時間前に投与

■パーキンソン病：分1～分3

■シャイドレーガー症候群、家族性アミロイドポリニューロパチー：分2～分3

【透析患者への投与方法】起立性低血圧を伴う血液透析患者におけるめまい・ふらつき・たちくらみ、倦怠感、脱力感の改善には200～400mgを透析開始30分から1時間前に経口投与 (1) tmax が遅いため透析時の低血圧予防には透析開始2～3hr前に投与の方が効果的と考えられる (5)

【その他の報告】透析1時間前に200～400mgの投与により透析中の低血圧は73.5%改善し、透析後も64.7%の患者で効果が持続した [対象にはDMは含まれていない] (Nephrol Dial Transplant 9: 1130-5, 1994)

400mg/日投与では血漿ドロキシドパ濃度の蓄積性はないが血漿ノルエピネフリン濃度は高値が持続する (臨床透析 14: 121-5, 1998)

透析後の起立後の血圧低下が有意に抑制され、立ちくらみ、めまい、ふらつき、起立障害などの症状が軽減する (腎と透析 43: 571-83, 1997)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】ノルエピネフリンの前駆物質の経口剤。パーキンソン病、シャイドレーガー症候群、家族性アミロイドポリニューロパチーに有用性が認められている。昇圧効果の発現はゆっくり。

【主な副作用・毒性】悪性症候群、血圧上昇、動悸、消化器症状、頭痛・頭重感、血球減少、精神神経症状、倦怠感、AST・ALT上昇、幻覚、チアノーゼなど

【吸収】遅いためtmaxは3時間 (Suzuki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 23: 463-8, 1982) 高脂肪・高カロリー食によりCmax, AUCが低下 (Chen JJ, et al: Drugs R D 18: 77-86, 2018 PMID: 29392574)

【F】65～73% [ラット] (1)

【tmax】健常者では3hr、血漿ノルアドレナリン濃度は5hr後にピークに達するが血圧には変化なし、病態によりtmaxは8hrに延長することもある (Suzuki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 23: 463-8, 1982) 透析患者で300mg投与で6hr、その時のCmaxは平均1.43μg/mL。血漿ノルアドレナリン濃度は24hr後に1.28ng/mLのピークに達する (Nephrol Dial Transplant 9: 1130-5, 1994) 透析患者で投与5～36hrまで血漿ノルエピネフリン濃度は持続する (1)

【代謝】生体内に広く存在する芳香族L-アミノ脱炭酸酵素により直接ノルエピネフリンに代謝される。主代謝物は3-メトキシ体 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率20% [12hrまで] (Suzuki T, et al: Eur J Clin Pharmacol 23: 463-8, 1982) 15% [po, 24hrまで]、3-メトキシ体として6%が尿中に回収 (1)

【t1/2】1.5hr (1)

【蛋白結合率】22%以下 (1)

【分布】脳内に移行する (1)

【MW】213.19

【透析性】未変化体およびノルエピネフリンともにダイアリザンスはクレアチニンと同等 (1) HDクリアランス 125mL/min (1)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない

【O/W係数】 1.05×10^{-3} [1-オクタノール水系, pH7] (1) 【pKa】7.88 (1)

【相互作用】鉄剤とキレート形成して吸収低下 [animal model] (1)

【備考】HD終了後の起立時に収縮期血圧が15mmHg以上低下する患者であること。本薬の作用機序は不明であり、治療後の血圧低下の減少度は個体内変動を超えるものではない。用法 (透析開始30minから1hr前に経口投与)・用量を遵守し、透析後の追加など過剰投与 (過度の昇圧反応が見られることがある) にならないように注意すること。糖尿病を合併した血液透析患者への適用に当たっては、糖尿病の程度 (末梢循環、血圧、血糖管理などの状態や、血管合併症の程度など) に十分留意すること。血液透析患者への適用に当たっては、1ヵ月間投与しても効果が認められない場合には、投与を中止すること (1)

【更新日】20210703

※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。