

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ニトラゼパム	ネルボン、ベンザリン、チスポシ、ネルロレン、ノイクロニック、ヒルスカミン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
1.不眠症 2.麻酔前投薬 3.異型小発作群 点頭てんかん、ミオクロムス発作、失立発作等 焦点性発作 焦点性けいれん発作、 精神運動発作、自律神経発作等	・不眠症：1回5～10mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 ・麻酔前投薬：1回5～10mgを就寝前または手術前に経口投与する。年齢・症状・疾患により適宜増減。 ・抗てんかん剤として用いる場合：1日5～15mgを適宜分割投与する。年齢・症状により適宜増減。	高齢者では運動失調等の副作用が発現しやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。	
薬物動態				
海外における検討では、健康成人6例にニトラゼパム10mgを経口投与した場合、速やかに吸収(53～94%)され、未変化ニトラゼパムの血漿中濃度は投与後約2時間後に最高に達し、その時の血漿中濃度は、平均84ng/mL(68～108ng/mL)である。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
5mg： 1.6 ± 1.2 hr (n=8, 健康成人) (空腹時単回経口投与)	5mg： 75.8 ± 28.9 ng/mL (n=8, 健康成人) (空腹時単回経口投与)	5mg： 27.1 ± 6.1 hr (n=8, 健康成人) (空腹時単回経口投与)	5mg： 929.3 ± 263.6 ng·hr/mL (n=8, 健康成人) (空腹時単回経口投与)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	中枢神経抑制剤(フェニチン誘導体、バルビツール酸誘導体等、(クロルプロマジン、フェノバルビタール等))	作用↓ 投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	アルコール	作用↓ 投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	MAO阻害剤	作用↓	本剤の代謝↓
注意	シメチジン	作用↓	代謝酵素阻害作用により、本剤の代謝↓血漿中濃度↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
パシプロラ エキス	パシプロラミン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
神経症における不安・緊張・ 焦燥・抑うつ・睡眠障害 心身症(自律神経失調症、 過敏性腸症候群、本態性高 血圧症、消化性潰瘍)にお ける身体症状並びに不安・ 緊張・抑うつ・睡眠障害	1回30mgを1日3回食後に経口投与する。年齢、症状により適 宜増減。	-	一般に高齢者では生理機 能が低下しているので注意 すること。	
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
-	-	-	-	
併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子	
-	-	-	-	

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ペントバルビタール	ラボナ	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症、麻酔前投薬、不安緊張状態の鎮静、持続睡眠療法における睡眠調節	<ul style="list-style-type: none"> <li>・不眠症： 1回50～100mgを就寝前に経口投与する。年齢、症状により適宜増減。</li> <li>・麻酔前投薬： 手術前夜100～200mg、手術前1～2時間に100mgを経口投与する。年齢、症状により適宜増減。</li> <li>・不安緊張状態の鎮静： 1回25～50mgを1日2～3回経口投与する。年齢、症状により適宜増減。</li> </ul>		一般に高齢者では、めまい、運動失調、呼吸抑制等の副作用があらわれやすい。	少量から投与を開始するなど、慎重に投与すること。
薬物動態	-			
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
100mg：1 hr (n=10, 健康成人男子(外国人))	100mg：1.37±0.06 μg/mL1 (n=10, 健康成人男子(外国人))	100mg：15～48 hr2 (n=10, 健康成人男子(外国人))	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	アルコール	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	抗ヒスタミン剤((シフェンヒドラミン、塩酸プロメタジン等))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	フェノチアジン系薬剤((クロロプロマジン、ハロペリドール等))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	催眠・鎮静剤((アモバルビタール、トリクロホスナトリウム等))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	三環系抗うつ剤((塩酸イミプラミン、塩酸アミトリプチリン、塩酸ノルトリプチリン))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	抗不安剤((ジアゼパム、ニトラゼパム))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	解熱・鎮痛剤((イブプロフェン、ジクロフェナクナトリウム、アセトアミノフェン))	中枢神経抑制作用(催眠、鎮静、昏睡等)↑ 定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	チアシド系薬物((シクロペンチアシド、トリクロルメチアシド等))	起立性低血圧があらわれることがある。異常が認められた場合には、本剤を減量するなど適切な処置を行う。	機序不明
注意	ジスルフィラム	起立性低血圧があらわれることがある。	ジスルフィラムが本剤の代謝を阻害する。
注意	クラーレ標物質((ツボクラリン、バンクロニウム))	筋弛緩作用、呼吸抑制作用↑ 異常が認められた場合には、本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加作用
注意	ワルファリンカリウム	抗凝血作用↑ 頻回にプロトロンビン値の測定を行い、ワルファリンカリウムの用量を調節する。	ワルファリンカリウムの代謝↑、半減期↓、クリアランス↑
注意	ドキシサイクリン	ドキシサイクリンの抗菌作用↑ 併用する場合には、用量に注意する。	ドキシサイクリンの代謝↑、半減期↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
<b>フェノバルビタール</b>	フェノバル、フェノバルビタール、ベグタミン、ルピアール、ワコビタール	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症 不安緊張状態の鎮静 てんかんのけいれん発作 強直間代発作(全般けいれん発作、大発作)、 焦点発作(ジャクソン型発作を含む) 自律神経発作、精神運動発作	1日30～200mgを1～4回に分けて経口投与する。 不眠症の場合は、1回30～200mgを就寝前に経口投与する。 年齢、症状により適宜増減。  (用法及び用量に関連する使用上の注意) 不眠症には、就寝の直前に服用させること。また、服用して就寝した後、睡眠途中において一時的に起床して仕事等をする可能性があるときは服用させないこと。	呼吸抑制、興奮、拘うつ、錯乱等があらわれやすい。 高齢者では離脱症状として起こるてんかん重複状態に特に注意すること。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。なお、投与を中止する場合には、徐々に減量するなど慎重に行うこと。	
薬物動態				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
末120mg：2.4±0.9 hr 散10%120mg：2.4±0.9 hr 錠30mg×4錠：1.4±0.5 hr エリキシル0.4%120mg：1.0±0.0 hr (n=5, 健康成人男子)	末120mg：4.6±0.4 ng/mL 散10%120mg：4.8±0.2 ng/mL 錠30mg×4錠：5.0±0.5 ng/mL エリキシル0.4%120mg：4.9±0.7 ng/mL (n=5, 健康成人男子)	末120mg：131.1±34.0 hr 散10%120mg：105.9±15.4 hr 錠30mg×4錠：119.0±18.6 hr エリキシル0.4%120mg：94.5±17.7 hr (n=5, 健康成人男子)	末120mg：175.2±17.6 ng·hr/mL 散10%120mg：177.4±12.7 ng·hr/mL 錠30mg×4錠：186.6±20.4 ng·hr/mL エリキシル0.4%120mg：176.0±17.7 ng·hr/mL (n=5, 健康成人男子)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
禁忌	ポリコナゾール((末、散、錠)、(ブイフェンド))	ポリコナゾールの代謝↑、血中濃度↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用による。
禁忌	ポリコナゾール((エリキシル)、(ブイフェンド))	ポリコナゾールの代謝↑、血中濃度↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用による。
禁忌	ジスルフィラム((ノックピン)、シアナド)	これらの薬剤とのアルコール反応(顔面潮紅、血)	エリキシル剤はエタノールを含有しているため。
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、)	相互に作用↑	相加作用
注意	抗ヒスタミン剤(ジフェンヒドラミン等)	相互に作用↑	相加作用
注意	アルコール	相互に作用↑	相加作用
注意	MAO阻害剤	相互に作用↑	機序不明
注意	三環系抗うつ剤(イミプラミン等)	(1)相互に作用↑	(1)相加作用
注意	四環系抗うつ剤(マプロチリン等)	(1)相互に作用↑	(1)相加作用
注意	メチルフェニデート	本剤の血中濃度↑	メチルフェニデートが肝代謝を抑制すると考え
注意	バルプロ酸	(1)作用↑	(1)バルプロ酸により本剤の肝代謝↓、血中濃
注意	クロバザム	(1)本剤の血中濃度↑	(1)機序不明
注意	イリノテカン	イリノテカン作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、イレノ
注意	副腎皮質ホルモン剤(デキサメタゾン等)	これらの薬剤の作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、これら
注意	カルバマゼピン	カルバマゼピンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、カル
注意	シクロスポリン	シクロスポリンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、シクロ
注意	テオフィリン	テオフィリンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、テオ
注意	アミノフィリン水和物	これらの薬剤の作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、これら
注意	卵巣ホルモン剤・黄体ホルモン剤、ノルゲス	これらの薬剤の作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、これら
注意	ベラミル	ベラミルの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、ベラ
注意	フェロジピン	フェロジピンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、フェロ
注意	クロラムフェニコール	クロラムフェニコールの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、クロラ
注意	フレカイニド	フレカイニドの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、フレカ
注意	パロキセチン	パロキセチンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、パロキ
注意	グリセオフルビン	グリセオフルビンの作用↓	本剤の消化管ぜん動運動亢進作用によるグリ
注意	ドキシサイクリン	ドキシサイクリンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、ドキシ
注意	タクロリムス	タクロリムスの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、タクロ
注意	サキナビル	サキナビルの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、サキ
注意	インジナビル	インジナビルの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、インジ
注意	トロピセトロン	トロピセトロンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、トロピ
注意	イマチニブ	イマチニブの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、イマ
注意	アゼルニジピン	アゼルニジピンの作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、アゼ
注意	クマリン系抗凝薬(ワルファリン)	クマリン系抗凝薬の作用↓	本剤の肝薬物代謝酵素誘導作用による。
注意	利尿剤(チアジド系降圧利尿剤等)	起立性低血圧が増強されることがある。	機序は不明であるが、高用量の本剤は血圧を
注意	アセタラミド	ケル病、骨軟化症があらわれやすい。	本剤によるビタミンDの不活性化促進。又はア
注意	セイヨウオトギリソウ(St. John's wort、セント・	本剤の作用↓	セイヨウオトギリソウの肝薬物代謝酵素誘導作



一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
クアゼパム	ドラーレ	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者への投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症 麻酔前投薬	不眠症 1回20mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状・疾患により適宜増減するが、1日最高量は30mgとする。 麻酔前投薬 手術前夜：1回15～30mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状・疾患により適宜増減するが、1日最高量は30mgとする。		高齢者への投与時の影響 運動失調等の副作用が現れやすい。	高齢者への投与方法 少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。

#### 薬物動態

本剤の吸収は食事の影響を受け、そのバイオアベイラビリティは増大する。

Tmax	Cmax	T1/2	AUC
絶食時投与15mg： 3.42±1.63 hr 食後30分後投与15mg： 3.67±0.52 hr (mean±SD, n=6, 健康成人男子)	絶食時投与15mg： 15.36±6.07 ng/mL 食後30分後投与15mg： 47.90±17.49* ng/mL (mean±SD, n=6, 健康成人男子)	絶食時投与15mg： 36.60±7.26 hr 食後30分後投与15mg： 31.91±7.10 hr (mean±SD, n=6, 健康成人男子)	絶食時投与15mg： 287.91±79.59 ng·hr/mL 食後30分後投与15mg：※ 621.99±263.54 ng·hr/mL (mean±SD, n=6, 健康成人男子)

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
禁忌	食物	過度の鎮静や呼吸抑制	経溶性薬物である本剤は、胃内容物の残留によって吸収性が向上し、未変化体及びその代謝物の血漿中濃度↑(空腹時の2～3倍)
禁忌	リトナビル(ノービア)	過度の鎮静や呼吸抑制	リトナビルのテトクロームP450iに対する競合的阻害作用により、併用した場合、本剤の血中濃度が大幅に上昇することが予測される。
注意	アルコール(飲酒)	中枢神経抑制作用↑を増強することがある。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑を増強することがある。	相加作用
注意	MAO阻害剤	中枢神経抑制作用↑を増強することがある。	相加作用
注意	シメチジン	本剤の作用↑	シメチジンのCYP阻害作用により、本剤の代謝↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
リルマザホン	リスミー、塩酸リルマザホン錠「MEEK」	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症 麻酔前投薬	<p>・不眠症：1回1～2mgを就寝前に経口投与する。年齢・疾患・症状により適宜増減するが、高齢者には1回2mgまでとする。</p> <p>・麻酔前投薬：1回2mgを就寝前又は手術前に経口投与する。年齢・疾患・症状により適宜増減するが、高齢者には1回2mgまでとする。</p>		運動失調等の副作用が現れやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。

薬物動態			
血漿中濃度(総活性代謝物の薬物動態パラメータ(測定法:HPLC))			
(1) 単回投与 健康成人男性4例にリルマザホン塩酸塩錠2mgを空腹時経口投与したとき、血漿中に未変化体は認められず、4種の活性代謝物(「3. 代謝」の項参照)が認められた。			
(2) 腎不全患者における血漿中濃度 健康成人男性4例にリルマザホン塩酸塩錠2mgを投与した群と腎不全患者5例にリルマザホン塩酸塩錠1mgを投与した群の、血漿中濃度シミュレーションはほぼ同等であった。			
(3) 反復投与 健康成人男性にリルマザホン塩酸塩錠2mg反復投与(22日間)後の血漿中活性代謝物濃度は、初回投与後の測定値より求めた薬物動態パラメータから予測された血漿中濃度とほぼ等しく、反復投与による薬物動態の変動は認められなかった。活性代謝物のうち、最も遅く生成するM-3の血漿中濃度は投与後3日目に定常状態となり、投与中止後3日目には消失した。			
Tmax	Cmax	T1/2	AUC
2mg : 3.0 ± 0.0 hr (mean ± SD, n=4, 健康成人男性)	2mg : 7.6 ± 2.5 ng/mL (mean ± SD, n=4, 健康成人男性)	2mg : 10.5 ± 2.6 hr (mean ± SD, n=4, 健康成人男性)	2mg : 122.8 ± 42.0 ng·hr/mL (mean ± SD, n=4, 健康成人男性)

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	アルコール	中枢神経抑制作用↑ 併用しないことが望ましい。やむを得ず併用する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑ 併用しないことが望ましい。やむを得ず併用する場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	MAO阻害剤	中枢神経抑制作用↑ 併用しないことが望ましい。やむを得ず併用する場合には慎重に投与する。	本剤の代謝↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
セコバルピタール	アイオナール	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症、麻酔前投薬、全身麻酔の導入、不安緊張状態の緩和	1回100～200mg(5%溶液※2～4mL)を徐々に静脈内注射するか、又は筋肉内注射する。 年齢・症状により適宜増減するが、総量500mgを超えないことが望ましい。		-	一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。
薬物動態				
麻酔前投薬として上腕筋肉内に投与した結果、60分後の血中濃度は2mg/kg：3.1mg/L、3mg/kg：5.4 mg/L、4mg/kg：10.2 mg/L。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
2mg/kg：30～40分 3mg/kg：30～40分 4mg/kg：30～40分 (成人患者)	2mg/kg：5.8 mg/L 3mg/kg：10.3 mg/L 4mg/kg：17.6 mg/L (成人患者)	-	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	アルコール	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗不安薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗精神薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	催眠鎮静薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗うつ薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗ヒスタミン薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	抗パーキンソン薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	解熱鎮痛薬	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	チアジド系薬物	起立性低血圧↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	クラーレ標物質	筋弛緩作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	ジスルフィラム	中枢神経抑制作用↑ 減量するなど慎重に投与する。	薬物代謝酵素抑制によりバルピツール酸系薬剤の代謝↓
注意	タマリン系抗凝薬	タマリン系抗凝薬の作用↓ 通常より頻回にプロトロンビン値の測定を行い、タマリン系抗凝薬の用量を調節する。	薬物代謝酵素誘導により、タマリン系抗凝薬の代謝↑
注意	ドキシサイクリン	ドキシサイクリンの作用↓	薬物代謝酵素誘導により、ドキシサイクリンの代謝↑血中濃度半減期↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
トリアゾラム	ハルシオン、アサンオン、アスコマーナ、カムリン、トリアゾラム、「EMEC」、トリアゾラム、ネスゲン、ハルラック、バルレオン、ミンザイン	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
不眠症 麻酔前投薬	<p>・不眠症：1回0.25 mgを就寝前に経口投与する。高度な不眠症には0.5 mgを投与することができる。年齢・症状・疾患などを考慮して適宜増減するが、高齢者には1回0.125 mg～0.25 mgまでとする。</p> <p>・麻酔前投薬：手術前夜：1回0.25mgを就寝前に経口投与する。年齢・症状・疾患などを考慮し、必要に応じて0.5 mgを投与することができる。</p>		運動失調等の副作用が発現しやすい。	少量から投与を開始すること。
薬物動態	-			
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
トリアゾラム錠0.125mg「EMEC」： 0.89±0.37 hr (Mean±SD, n=16, 健康成人男性)	トリアゾラム錠0.125mg「EMEC」： 1.66±0.51 ng/mL (Mean±SD, n=16, 健康成人男性)	トリアゾラム錠0.125mg「EMEC」： 3.55±0.95 hr (Mean±SD, n=16, 健康成人男性)	トリアゾラム錠0.125mg「EMEC」： 8.82±2.43 ng・hr/mL (Mean±SD, n=16, 健康成人男性)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
禁忌	イトラコナゾール((イトリゾール))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	フルコナゾール((ジフルカン))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	ホスフルコナゾール((プロジフ))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	ボリコナゾール((ブイフェンド))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	ミコナゾール(フロリード)	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	HIV プロテアーゼ阻害剤(インジナビル(クリキシバン)、リトナビル(ノービア)等。)	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
禁忌	エファビレンツ((ストックリン))	本剤の作用↑及び作用時間↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	アルコール	中枢神経抑制作用が増強される。できるだけ飲酒は避けさせること。	相加作用?
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用が増強される。	相加作用?
注意	エリスロマイシン	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	クラリスロマイシン	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	ジョサマイシン	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	シメチジン	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	ジルチアゼム	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	メシル酸イマチニブ	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	キヌプリスチン・(ダルホプリスチン)	本剤の作用↑	どちらもCYP3A4で代謝されるため、本剤の代謝↓血中濃度↑
注意	リファンピシン	本剤の作用↓	本剤の代謝↑
注意	MAO阻害剤	多汗、起立性低血圧等のがあらわれる	機序不明



一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
トリクロホスナトリウム	トリクロリール	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症 脳波・心電図検査等における睡眠	1回1～2g(シロップとして10～20mL)を就寝前又は検査前に経口投与する。幼小児は年齢により適宜減量する。患者の年齢及び状態、目的等を考慮して、20～80mg/kg(シロップとして0.2～0.8mL/kg)を標準とし、総量2g(シロップとして20mL)を超えないようにする。	呼吸抑制を起こすおそれがある。また、一般に副作用があらわれやすい。	少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。	
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
22.5mg/kg : 22.5mg/kg : 1 hr (n=7, 健康成人(外国人))	22.5mg/kg : 8.2±0.6 µg/mL (n=7, 健康成人(外国人))	22.5mg/kg : 8.2 hr (n=7, 健康成人(外国人)) (T1/2 β)	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	アルコール	アルコールの作用↑(中枢神経抑制作用↑もある?) やむを得ず投与する場合には減量するなど慎重	アルコール脱水素酵素を競合的に阻害し、アルコールの血中濃度↑
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑ やむを得ず投与する場合には減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	MAO阻害剤	中枢神経抑制作用↑ やむを得ず投与する場合には減量するなど慎重に投与する。	相加作用
注意	クマリン系抗凝血剤(ワルファリン等)	クマリン系抗凝血剤の作用↑ 通常より頻回にプロトロンビン値の測定を行うなど慎重に投与する。	トリクロホスナトリウムの主代謝産物であるトリクロル酢酸が血漿蛋白結合部位からワルファリンを遊離置換し、遊離型ワルファリン濃度を増加させる。

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ソルビデム	マイスリー	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者への投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症 (統合失調症及び躁うつ病に伴う不眠症は除く)	1回5～10mgを就寝直前に経口投与する。高齢者には1回5mgから投与を開始する。年齢・症状・疾患により適宜増減するが、1日10mgを超えないこととする。	運動失調が起こりやすい。また、副作用が現れやすい。	少量(1回5mg)から投与を開始し、1回10mgを超えないこと。	
薬物動態				
<p>・健康成人 健康成人6例に酒石酸ソルビデム錠2.5～10mgを空腹時に単回経口投与したところ、ソルビデムは速やかに吸収され、投与後0.7～0.9時間に最高血漿中濃度(C<sub>max</sub>)に達した後、消失半減期(t<sub>1/2</sub>)1.78～2.30時間で速やかに減少した。 C<sub>max</sub>及び血漿中濃度-時間曲線下面積(AUC)は投与量に比例して増加した1)。また、健康成人6例に酒石酸ソルビデム錠10mgを1日1回7日間朝食後に経口投与したところ、血漿中濃度推移は1日目と7日目とほぼ同じであった。</p> <p>・高齢患者 高齢患者7例(67～80歳、平均75歳)に酒石酸ソルビデム錠5mgを就寝直前に経口投与したところ、高齢患者の方が健康成人に比べてC<sub>max</sub>で2.1倍、最高血漿中濃度到達時間(t<sub>max</sub>)で1.8倍、AUCで5.1倍、t<sub>1/2</sub>で2.2倍大きかった。</p> <p>・肝機能障害患者(外国人データ) 肝硬変患者8例に酒石酸ソルビデム錠20mgを経口投与したところ、同年齢の健康成人に比べてC<sub>max</sub>は2.0倍、AUCは5.3倍大きかった。</p> <p>・腎機能障害患者(外国人データ) 慢性腎障害を有する患者16例(C<sub>cr</sub>:0～47mL/min)に酒石酸ソルビデム錠10mgを20分間静脈内持続注入したところ、健康成人に比べβ相での分布容量(V<sub>dβ</sub>)のみ有意に大きかった。</p> <p>また、透析を受けている慢性腎障害患者9例に酒石酸ソルビデム錠10mgを1日1回13～18日間経口投与したときの血漿中濃度は単回投与時とほぼ同じであり、血中の蓄積は認められなかった。</p>				
T <sub>max</sub>	C <sub>max</sub>	T <sub>1/2</sub>	AUC	
2.5 mg : 0.7 ± 0.3 hr 5.0 mg : 0.8 ± 0.3 hr 7.5 mg : 0.9 ± 0.6 hr 10.0 mg : 0.8 ± 0.3 hr (Mean ± SD, n=6, 健康成人)	2.5 mg : 32.6 ± 9.6 ng/mL 5.0 mg : 76.2 ± 29.7 ng/mL 7.5 mg : 102 ± 42 ng/mL 10.0 mg : 120 ± 73 ng/mL (Mean ± SD, n=6, 健康成人)	2.5 mg : 1.78 ± 0.48 hr 5.0 mg : 2.06 ± 1.18 hr 7.5 mg : 1.86 ± 0.47 hr 10.0 mg : 2.30 ± 1.48 hr (Mean ± SD, n=6, 健康成人)	2.5 mg : 96 ± 58 ng·hr/mL 5.0 mg : 259 ± 218 ng·hr/mL 7.5 mg : 330 ± 163 ng·hr/mL 10.0 mg : 491 ± 474 ng·hr/mL (Mean ± SD, n=6, 健康成人)	
20mg : 0.69 ± 0.54 hr (Mean ± SD, n=8, 肝硬変患者) 20mg : 0.72 ± 0.42 hr (Mean ± SD, 健康成人)	肝硬変患者20mg : 499 ± 215 ng/mL (Mean ± SD, n=8, 肝硬変患者) 健康成人20mg : 250 ± 57 ng/mL (Mean ± SD, 健康成人)	20mg : 9.91 ± 7.57 hr (Mean ± SD, n=7, 肝硬変患者) 健康成人20mg : 2.15 ± 0.25 hr (Mean ± SD, 健康成人)	20mg : 4203 ± 3773 ng·hr/mL (Mean ± SD, n=8, 肝硬変患者) 健康成人20mg : 788 ± 279 ng·hr/mL (Mean ± SD, 健康成人)	
透析患者単回投与10mg : 1.7 ± 1.0 hr (Mean ± SD, n=11, 透析患者) 透析患者反復投与10mg : 0.8 ± 0.6 hr (Mean ± SD, n=9, 透析患者)	透析患者単回投与10mg : 172 ± 96 ng/mL (Mean ± SD, n=11, 透析患者) 透析患者反復投与10mg : 203 ± 96 ng/mL (Mean ± SD, n=9, 透析患者)	透析患者単回投与10mg : 2.4 ± 1.3 hr (Mean ± SD, n=11, 透析患者) 透析患者反復投与10mg : 2.5 ± 1.2 hr (Mean ± SD, n=9, 透析患者)	透析患者単回投与10mg : 796 ± 527 ng·hr/mL (Mean ± SD, n=11, 透析患者) 透析患者反復投与10mg : 930 ± 651 ng·hr/mL (Mean ± SD, n=9, 透析患者)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	麻酔剤	呼吸抑制 慎重に投与する。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑ 慎重に投与する。	相加作用
注意	アルコール(飲酒)	精神機能・知覚・運動機能等↓ (中枢神経抑制作用↑)	相加作用
注意	リファンピシン	本剤の作用↓	CYP3A4の誘導により本剤の代謝↑、血中濃度↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
ゾピクロン	アモバン、アモバンテス、ア ントマイリン、スローハイム、 ゾピクール、ゾピクロン、ゾピ バン、ドパリアル、ネローム	-	-	-
分類				
睡眠薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
不眠症 麻酔前投薬	不眠症：1回7.5～10mgを就寝前に経口投与する。年齢・症 状により適宜増減するが、10mgを超えないこと。 麻酔前投薬：1回7.5～10mgを就寝前または手術前に経口 投与する。年齢・症状・疾患により適宜増減するが、10mgを超 えないこと。	運動失調が起こりやすい。 また、副作用が発現しやす い。	少量(1回3.75mg)から投与 を開始すること。	
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
ゾピクール7.5mg： 1.0±0.5 hr ゾピクール10mg： 0.9±0.5 hr (健康成人男子)	ゾピクール7.5mg： 70.4±16.8 ng/mL ゾピクール10mg： 76.6±24.6 ng/mL (健康成人男子)	ゾピクール7.5mg： 4.6±1.3 hr ゾピクール10mg： 5.1±1.0 hr (健康成人男子)	ゾピクール7.5mg： 375.3±79.7 ng·hr/mL ゾピクール10mg： 510.1±114.4 ng·hr/mL (健康成人男子)	

併用	併用薬剤名	臨床症状	機序・危険因子
注意	筋弛緩薬((スキサトニウム塩化物水和物、 ツボクラリン塩化物塩酸塩水和物、バンクロニ ウム臭化物))	抗痙攣作用・中枢神経抑制作用↓ 併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与す る場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤((フェンチアジン誘導体、パ ルピツール酸誘導体等))	抗痙攣作用・中枢神経抑制作用↓ 併用しないことが望ましいが、やむを得ず投与す る場合には慎重に投与する。	相加作用
注意	アルコール(飲酒)	中枢神経抑制作用↓	相加作用
注意	麻酔時	呼吸抑制 慎重に投与する。	相加作用
注意	CYP3A4を誘導する薬剤(リファンピシン等)	本剤の作用↓	CPY3A4誘導により、本剤の代謝↑
注意	CYP3A4を阻害する薬剤(エリスロマイシン、 イトラコナゾール等)	本剤の作用↑	CPY3A4阻害により、本剤の代謝↑

補足資料：

向精神薬の薬物動態、高齢者へ投与する際の注意点、併用禁忌・注意情報

## 2. 抗うつ薬



一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
アミトリプチリン	トリプタノール、ノーマルン、アミプリン	CYP1A2 CYP2C19 CYP2D6 CYP3A4	-	-
分類				
抗うつ薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
精神科領域におけるうつ病・うつ状態、夜尿症	うつ病・うつ状態：1日30～75mmを初期用量とし、1日150mmまで漸増し、分割経口投与する。まれに300mmまで増量することもある。年齢・症状により適宜減量。 ・夜尿症：1日10～30mmを就寝前に経口投与する。年齢・症状により適宜減量。	起立性低血圧、ふらつき、口渇、排尿困難、便秘、眼内圧亢進等があらわれやすい。	少量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与する。	
薬物動態				
うつ病患者15例にアミトリプチリン塩酸塩を2週間以上1日30mg、75mg、125～180mg 3分割経口投与したときのアミトリプチリンの血漿中濃度は、それぞれ36±5ng/mL、43±3ng/mL、79±10ng/mLであり、また代謝物であるノルトリプチリンの血漿中濃度はそれぞれ8±2ng/mL、22±4ng/mL、89±25ng/mLであった。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
-	-	-	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子
禁忌	MAO阻害薬(セレギリン)	発汗、不穏、全身痙攣、異常高熱、昏睡等があらわれることがある。MAO阻害薬の投与を受けた患者にアミトリプチリンを投与する場合には、少なくとも2週間の間隔をおき、またアミトリプチリンからMAO阻害剤に切りかえるときには、2～3日間の間隔をおくことが望ましい。	アミトリプチリンの代謝↓ また、アミトリプチリンが活性アミンのシナプス内への取り込みを阻害。
禁忌	チオリダジン	QT延長、心室性不整脈等を起こすことがある。	CYP2D6により代謝される本剤及びチオリダジンは、併用により競合的な代謝阻害を示し本剤又はチオリダジンの血中濃度が上昇する。
注意	CYP2D6阻害作用を有する薬剤(SSRI(フルボキサミン、パロキセチン)、抗不整脈薬(キニジン、プロパフェノン、フレカイニド)、シメチジン、フェノチアジン系薬剤)	アミトリプチリンの作用↑	CYP2D6阻害作用によりアミトリプチリンの代謝↓により血中濃度↑
注意	CYP3A4阻害作用を有する薬剤(リトナビル、ホスアンブレナビル)	アミトリプチリンの作用↑	CYP3A4阻害作用によりアミトリプチリンの代謝↓により血中濃度↑
注意	CYP3A4誘導作用を有する薬剤(カルバマゼピン、フェニトイン、セイヨウオトギリソウ(St. John's Wort)含有食品)	アミトリプチリンの作用↓	CYP3A4誘導作用によりアミトリプチリンの代謝↑により血中濃度↓
注意	ST合剤	アミトリプチリンの作用↓	機序不明
注意	アドレナリン作動薬(エピネフリン、ノルエピネフリン)	アドレナリン作動薬の作用↑	三環系抗うつ剤は交感神経末梢へのノルエピネフリンの取り込みを抑制し、受容体のアドレナリン作動性↑
注意	アルコール	アミトリプチリンの作用↑	アミトリプチリンの血中濃度↑
注意	カリウム製剤(徐放性、腸溶剤)	カリウム製剤の消化管粘膜刺激があらわれやすい	アミトリプチリンの抗コリン作用により消化管運動↓
注意	クマリン系抗凝薬(ワルファリンカリウム)	クマリン系抗凝薬の作用↑	アミトリプチリンの肝薬物代謝酵素阻害作用により、クマリン系抗凝薬の代謝↓
注意	コリン作動薬(ピロカルピン)	コリン作動薬の作用↓	アミトリプチリンがコリン作動薬の作用に拮抗する。
注意	バルプロ酸	アミトリプチリンの血中濃度↑	-
注意	塩酸トラマドール	虚寒発作の危険性が増大するとの報告がある	機序不明
注意	血糖降下薬(インスリン、経口血糖降下剤)	血糖降下薬の作用↑	機序は不明
注意	抗コリン薬(スコポラミン)	抗コリン作用↑	相加作用
注意	降圧剤(グアナネチジン、ベタネジン)	降圧薬の作用↓	アドレナリン作動性神経末梢でのグアナネチジンの取り込みを阻害し、降圧作用を減弱させる。
注意	中枢神経抑制薬(バルビツール酸誘導体)	アミトリプチリンの作用↓ アミトリプチリンが中毒量に達していたときにはアミトリプチリンの有害作用↑	治療濃度ではアミトリプチリンの肝代謝↓により血中濃度↓

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
アモキシシリン	アモキシサン	-	-	-
分類				
抗うつ薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
うつ病・うつ状態	1日25～75mgを1～数回に分経口投与する。効果不十分と判断される場合には1日量150mg、症状が特に重篤な場合には1日300mgまで増量することもある。		起立性低血圧、ふらつき、抗コリン作用による口渇、排尿困難、便秘、眼内圧亢進等があらわれやすい。	低用量から投与を開始するとともに、患者の状態を観察しながら、慎重に投与する。
薬物動態				
アモキシシリン及びその代謝物は主として尿中へグルクロン酸抱合体として排泄され、尿中排泄率は48時間では43%である(米国)。				
Tmax	Cmax	TI/2	AUC	
カプセル50mg：1.46 hr (n=26, 健康成人) (1回経口投与)	カプセル50mg：34.8ng/mL (n=26, 健康成人) (1回経口投与)	カプセル50mg： A：約8 hr B：約30 hr (n=26, 健康成人) (1回経口投与)	-	
アモキシシリン細粒10%×0.5gまたはアモキシシリンカプセル25mg×2 A：1～1.5 hr B：1.5～2.5 hr (n=14, 健康成人) (1回経口投与)	アモキシシリン細粒10%×0.5g A：46.7±16.4ng/mL B：37.3±11.9ng/mL アモキシシリンカプセル25mg×2 A：43.8±20.8ng/mL B：33.0±11.7ng/mL (n=14, 健康成人) (1回経口投与)	アモキシシリン細粒10%×0.5gまたはアモキシシリンカプセル25mg×2 A：24 hr後にほとんど消失 B：24 hr後も比較的高い値を示す (n=14, 健康成人) (1回経口投与)		
A = アモキシシリン未変化体 B = 8-ヒドロキシアモキシシリン(体内主要代謝物)	A = アモキシシリン未変化体 B = 8-ヒドロキシアモキシシリン(体内主要代謝物)	A = アモキシシリン未変化体 B = 8-ヒドロキシアモキシシリン(体内主要代謝物)		

併用	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子
禁忌	MAO阻害剤	MAO阻害薬の投与を受けた患者に本剤を投与する場合には、少なくとも2週間の間隔をおき、また本剤からモノアミン酸化酵素阻害剤に切りかえるときには、2～3日間の間隔をおくことが望ましい。	MAO阻害薬によってアモキシシリンの代謝↓ アモキシシリンが活性アミンのシナプス内への取り込みを阻害し、受容体の感受性↑
注意	SSRI	アモキシシリンの血中濃度↑	アモキシシリンの代謝↓
注意	ST合剤	アモキシシリンの作用↓	機序は明らかでないが、アモキシシリンの代謝促進又は作用部位での両剤の拮抗作用によるものと考えられている。
注意	アドレナリン作動薬(エピネフリン、ノルエピネフリン等)	アドレナリン作動薬の作用↑	アモキシシリンは交感神経末梢へのノルエピネフリンの取り込みを抑制し、受容体のアドレナリン作動性を上昇させ、作用を増強させることがある。
注意	アルコール	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	シメチジン	アモキシシリンの血中濃度↑	シメチジンにより、アモキシシリンの代謝↓
注意	抗コリン作動薬(トリヘキシフェニジル等)	抗コリン作用↑(口渇、排尿困難・乏尿、眼内圧亢進、視調節障害、便秘、鼻閉等)	相加作用
注意	降圧剤(グアナチジン)	降圧剤の作用↓	三環系抗うつ剤はアドレナリン作動性ニューロンでのグアナチジンの取り込みを阻害する
注意	中枢神経抑制剤(バルビツール、酸誘導体等)	中枢神経抑制作用↑	相加作用

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
イミプラミン	トフラニール、イミドール	-	-	-
分類				
抗うつ薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
精神科領域におけるうつ病・うつ状態 遺尿症（昼・夜）	・うつ病・うつ状態：1日25～75mgを初期用量とし、1日200mgまで増し、分割経口投与する。まれに300mgまで増量することもある。年齢・症状により適宜減量。 ・遺尿症：通常幼児は1日量25mgを1回、学童は1日量25～50mgを1～2回経口投与する。症状・年齢に応じ適宜増減。		起立性低血圧、ふらつき、抗コリン作用による口渇、排便困難、便秘、眼内圧亢進等があらわれやすい。	少量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。
薬物動態				
塩酸イミプラミンを経口投与した場合、通常1週間後に定常血漿中濃度に達し、その濃度は個人差が大きい。75mg/日投与の平均値では未変化体が70ng/mLを示し、活性代謝物デシプラミンが29ng/mLを示す(うつ病患者) (外国人のデータ)塩酸イミプラミンは経口投与により、速やかに、かつ完全に吸収される。経口投与の場合、筋肉内投与に比べ、デシプラミンに代謝される率が高い。連続経口投与した場合の血漿中半減期は未変化体が9～20時間、代謝物デシプラミンが13～61時間である(健康成人)。経口投与の場合、排泄は速やかに、最初から24時間までの尿中に投与量の約43%が、72時間までの尿中に合計72%が排泄され、残りは糞中に排泄される。ヒトでは尿中に未変化体のほか、desmethyl体、2-hydroxy体、2-hydroxy-desmethyl体、N-oxide体、水酸化体のグルクロン酸抱合体等の代謝物が確認されている(うつ病患者)				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
-	-	-	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子
禁忌	チオリダジン	QT延長、心室性不整脈等を起こすことがある。	チオリダジンは肝薬物代謝酵素CYP2D6を阻害し、イミプラミン又はその活性代謝物の代謝を遅延させる。また、両剤ともQT延長が報告されている。
禁忌	MAO阻害剤(セレギリン)	発汗、不穏、全身虚寒、異常高熱、昏睡等があらわれることがある。MAO阻害剤の投与を受けた患者に本剤を投与する場合には、少なくとも2週間の間隔をおき、また本剤からMAO阻害剤に切り替えるときには、2～3日間の間隔をおくことが望ましい。	イミプラミンは活性アミンのシナプス内への取り込みを阻害して、受容体の感受性を増強する。
注意	SNRI(ミルナシプラン、リチウム製剤)	セロトニン症候群があらわれるおそれがある。	相互にセロトニン作動性が増強される可能性がある。
注意	SSRI(フルボキサミン、パロキセチン)	イミプラミンの血中濃度↑ セロトニン症候群があらわれるおそれがある。	イミプラミンの代謝↓ 相互にセロトニン作動性が増強される
注意	ST合剤	イミプラミンの作用↑	イミプラミンの代謝↓ または両剤の受容体レベルでの拮抗作用によるものと考えられている。
注意	アドレナリン作動薬(エピネフリン、ノルエピネフリン、フェニレフリン 等)	アドレナリン作動薬の作用↑	三環系抗うつ薬は交感神経末梢へのノルアドレナリン等の取り込みを抑制する。
注意	インスリン製剤(インスリン)、スルホニル尿素系糖尿病用剤(グリベンklamid)	過度の血糖低下を来すとの報告がある。	他の三環系抗うつ剤(ドキサセピン)では低血糖に対する反応性が変化するか、インスリンに対する感受性が増大し、血糖降下作用が増強すると考えられている。
注意	クマリン系抗凝血剤(ワルファリン)	クマリン系抗凝血剤の血中濃度半減期↑	機序不明。他の三環系抗うつ薬(ノルトリプチン)で報告がある。
注意	シメチジン	イミプラミンの作用↑	シメチジンにより、イミプラミンの肝代謝が阻害され、血中濃度↑
注意	テルビナフィン	イミプラミンの活性代謝物の血中濃度↓	テルビナフィンのCYP2D6の阻害により、本剤又はその活性代謝物の代謝↓
注意	フェニトイン	フェニトインの作用↑	フェニトインの代謝が阻害され、フェニトインの血中濃度↑
注意	フェノチアジン系精神神経用剤(レボメプロラムジン 等)	抗コリン作用↑ 中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	ホスアンブレナビル	イミプラミンの血中濃度↑	ホスアンブレナビルの活性代謝物であるアンブレナビルがイミプラミンの代謝阻害する。
注意	メチルフェニデート	イミプラミンの作用↑	メチルフェニデートにより、イミプラミンの肝代謝が阻害され、血中濃度↑
注意	黄体・卵胞ホルモン製剤	イミプラミンの作用↑	黄体・卵胞ホルモン製剤により、イミプラミンの肝代謝が阻害され、血中濃度↑
注意	肝酵素誘導作用をもつ薬剤(バルビツール酸誘導体、フェニトイン、カルバマゼピン、リファンピシン 等)	イミプラミンの血中濃度↓	肝酵素誘導作用による。
注意	抗コリン作用を有する薬剤(トリヘキソフェンジル、アトロピン 等)	抗コリン作用↑(口渇、便秘、尿閉、視力障害、眼圧等)	相加作用
注意	抗不整脈剤(キニジン、プロパフェノン)	イミプラミンの作用↑	抗不整脈薬により、イミプラミンの肝代謝が阻害され、血中濃度↑
注意	降圧剤(グアナジジン)	降圧剤の作用↓	イミプラミンがアドレナリン作動性神経遮断作用を有する降圧剤の交感神経ニューロンへの取り込みを阻害する。また、本剤は交感神経ニューロンへのカテコラミン取り込み阻害作用も有する。
注意	中枢神経抑制剤(バルビツール酸誘導体等)、全身麻酔剤(ハロタン 等)、抗不安剤(アルプラゾラム 等)、アルコール	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	電気ショック療法	虚寒閾値を低下させる。	イミプラミンは虚寒閾値を低下させると考えられている。
注意	副交感神経刺激剤(ピロカルピン)	ピロカルピンの作用↓	イミプラミンの抗コリン作用に拮抗。



一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
クロミプラミン	アナプラール	-	-	-
分類				
抗うつ薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
精神科領域におけるうつ病・うつ状態 遺尿症	うつ病・うつ状態：1日50～100mgを1～3回に分割投与する。症状により適宜増減するが、1日最高量は225mgまでとする。 遺尿症：通常、6歳未満の幼児は1日10mg～25mgを、また6歳以上の学童は1日20mg～50mgを1～2回に分割投与する。症状・年齢により適宜増減。		起立性低血圧、ふらつき、抗コリン作用による口渇、排尿困難、便秘、眼内圧亢進等があらわれやすい。	少量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与する。
薬物動態				
クロミプラミン塩酸塩を平均125mg/日経口投与した場合、投与開始後1～2週目で定常状態に達し、クロミプラミン、活性代謝物デスメチルクロミプラミンの血漿中濃度は、それぞれ139、266ng/mLである。 なお、点滴静注の場合、経口投与に比べ、デスメチルクロミプラミンに代謝される率が低い(うつ病患者)。 排泄は2/3が抱合体で尿中に、また約1/3は糞便中に排泄される。未変化体及び活性代謝物の尿中排泄は投与量の1%以下である。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
1mg/kg：1.5～4 hr	-	1mg/kg：約21 hr (β相)	-	

併用	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子
禁忌	MAO阻害剤 セレギリン	発汗、不穏、全身虚脱、異常高熱、昏睡等があらわれることがある。MAO阻害剤の投与を受けた患者に本剤を投与する場合には、少なくとも2週間の間隔をおき、また本剤からMAO阻害剤に切り替えるときには、2～3日間の間隔をおくことが望ましい。	クロミプラミンは活性アミンのシナプス内への取り込みを阻害して、受容体の感受性を増強する。
禁忌	チオリダジン	QT延長、心室性不整脈等を起こすおそれがある。	チオリダジンによってCYP2D6が阻害され、クロミプラミン又はその活性代謝物の代謝を遅延させる。また両剤ともQT延長が報告されている。
注意	SNRI(ミルナシブラン、リチウム製剤)	セロトニン症候群のおそれあり。	相加作用
注意	SSRI	クロミプラミンの血中濃度↑ セロトニン症候群のおそれあり。	SSRIによる代謝を阻害。また、相互にセロトニン作動性をもつ。
注意	ST合剤	クロミプラミンの作用↓	クロミプラミンの代謝促進又は両剤の受容体レベルでの拮抗作用によるものと考えられている。
注意	アドレナリン作動薬(アドレナリン、ノルアドレナリン、フェニレフリン 等)	アドレナリン作動薬の作用↑	クロミプラミンは交感神経末梢へのノルアドレナリン等の取り込みを抑制する。
注意	アンプレナビル、ホスアンプレナビル	クロミプラミンの血中濃度↑	アンプレナビルは本剤の代謝を競合的に阻害すると考えられる。
注意	インスリン製剤(インスリン)、スルフォニル尿素系糖尿病用剤(グリベンklamid)	過度の血糖低下を来すことがある。	クロミプラミンでの機序は不明。他の三環系抗うつ剤(ドキシセピン)では低血糖に対する反応性が変化するか、インスリンに対する感受性が増大し、血糖降下作用が増強すると考えられている。
注意	クマリン系抗凝薬(ワルファリン)	クマリン系抗凝薬の血中濃度半減期↑	機序不明。他の三環系抗うつ剤(ノルトリプチン)で報告あり。
注意	テルビナフィン	クロミプラミンの血中濃度↑	テルビナフィンのCYP2D6の阻害により、他の三環系抗うつ剤(イミプラミン)又はその活性代謝物の代謝が遅延する。
注意	フェニトイン	フェニトインの作用↑	他の三環系抗うつ剤(イミプラミン)でフェニトインの代謝が阻害され、フェニトインの血中濃度が上昇するという報告がある。
注意	フェノチアジン系抗精神病薬(レボメプロマジン等)	抗コリン作用↑ 中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	肝酵素誘導作用をもつ薬剤(、バルビツール酸誘導体、フェニトイン、カルバマゼピン、リファンピシン 等)	クロミプラミンの血中濃度↓	肝酵素誘導作用による。
注意	抗コリン作用を有する薬剤(トリヘキシフェニジル、アトロピン 等)	抗コリン作用↑(口渇、便秘、尿閉、視力障害、眩暈等)	相加作用
注意	抗不整脈薬(キニジン、プロパフェノン)	クロミプラミンの血中濃度↑	イミプラミンの代謝↓の報告がある。
注意	メチルフェニデート	クロミプラミンの血中濃度↑	イミプラミンの代謝↓の報告がある。
注意	シメチジン	クロミプラミンの血中濃度↑	イミプラミンの代謝↓の報告がある。
注意	黄体・卵胞ホルモン製剤	クロミプラミンの血中濃度↑	イミプラミンの代謝↓の報告がある。
注意	降圧剤(グアネチジン)	降圧剤の作用↓	クロミプラミンがアドレナリン作動性神経遮断作用を有する降圧剤の交感神経ニューロンへの取り込みを阻害する。また、本剤は交感神経ニューロンへのカタコラミン取り込み阻害作用も有する。
注意	中枢神経抑制剤(バルビツール酸誘導体等)、全身麻酔薬(ハロタン等)、抗不安剤(アルプラゾラム等)、アルコール	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	電気ショック療法	感電閾値を低下させる。	クロミプラミンによって感電閾値↓
注意	副交感神経刺激剤(ピロカルピン)	ピロカルピンの作用↓	クロミプラミンの抗コリン作用に拮抗



一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
サフラジン	サフラ	-	-	-
分類				
抗うつ薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
-	-		-	-
薬物動態				
-				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
-	-	-	-	
併用	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子	
-	-	-	-	

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
スルピリド	ドグマチール、ミラドール、アブリット、スルピリド、マーグノール、ベタマック、ケールスパン、ケイチール、シーグル、スカノーゼン、スタマクリット、スベサニール、ニチマール、ピリカップル、ヨウマチール	-	-	-
分類				
抗うつ薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
統合失調症、うつ病・うつ状態	<ul style="list-style-type: none"> <li>胃・十二指腸潰瘍：スルピリドとして、1日150mgを3回に分割経口投与する。症状により適宜増減。</li> <li>統合失調症：1日300～600mgを分割経口投与する。年齢・症状により適宜増減し、1日1,200mgまで増量可。</li> <li>うつ病・うつ状態：1日150～300mgを分割経口投与する。年齢・症状により適宜増減し、1日600mgまで増量可。</li> </ul>	腎機能が低下している高齢者では高い血中濃度が持続するおそれがある。副作用（維体外踏症状等）の発現に注意する。	用量並びに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。	

薬物動態			
乳汁中移行 産褥期の初産婦 (n=20) にスルピリド50mgを1日2回7日間反復経口投与したとき、投与2時間後の乳汁中スルピリド濃度は0.97 μg/mLであった。			
Tmax	Cmax	T1/2	AUC
スルピリド錠50mg (TYK) : 2.42 ± 0.51 hr スルピリド錠100mg (TYK) : 2.33 ± 0.49 hr スルピリド錠200mg (TYK) : 2.33 ± 0.49 hr (健康成人男子) (空腹時単回投与)	スルピリド錠50mg (TYK) : 333.83 ± 46.19 ng/mL スルピリド錠100mg (TYK) : 570.92 ± 58.58 ng/mL スルピリド錠200mg (TYK) : 568.17 ± 50.78 ng/mL (健康成人男子) (空腹時単回投与)	スルピリド錠50mg (TYK) : 12.30 ± 5.24 hr スルピリド錠100mg (TYK) : 11.03 ± 1.94 hr スルピリド錠200mg (TYK) : 12.00 ± 1.97 hr (健康成人男子) (空腹時単回投与)	スルピリド錠50mg (TYK) : 3303.50 ± 375.02 ng·hr/mL スルピリド錠100mg (TYK) : 6212.08 ± 616.17 ng·hr/mL スルピリド錠200mg (TYK) : 6355.21 ± 572.61 ng·hr/mL (健康成人男子) (空腹時単回投与)

併用	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子
注意	QT延長を起こすことが知られている薬剤(チオリダジン、イミプラミン、ピモジド 等)	QT延長、心室性不整脈等の重篤な副作用を起こすおそれがある。	両薬剤はいずれもQT間隔を延長させるおそれがあるため、併用により作用が増強するおそれがある。
注意	アルコール(飲酒)	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	ジギタリス剤(ジゴキシン、ジギトキシン 等)	ジギタリス剤飽和時の指標となる悪心・嘔吐、食欲不振症状を顕性化するおそれがある。	本剤の制吐作用による。
注意	ドパミン作動薬(レボドパ 等)	相互に作用↓	作用が拮抗する。
注意	ベンザミド系薬剤(メクロプラミド、チアプリド 等)、フェノチアジン系薬剤(クロルプロマジン 等)、ブチフェノン系薬剤(ハロペリドール 等)	内分泌機能異常、維体外踏症状が発現しやすくなる。	相加作用
注意	中枢神経抑制剤(バルビツール酸誘導体、麻酔剤 等)	中枢神経抑制作用↑	本剤及びこれらの薬剤は中枢神経抑制作用を有する。

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
セチプチリン	テシプール	-	-	-
分類				
抗うつ薬				
効能・効果	用法・用量		高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法
うつ病・うつ状態	1日3mgを初期用量とし、1日6mgまで漸増し、分割経口投与する。年齢・症状により適宜増減。		80歳以上の患者において、血中濃度が高い傾向が報告されている。起立性低血圧、ふらつき等があらわれやすい。	少量から投与を開始するとともに、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。
薬物動態				
血漿中濃度 健康成人男子に1mg 単回経口投与した結果、投与1～3時間後に最高血漿中濃度を示し、以後、二相性で低下した。この時の $\alpha$ 相及び $\beta$ 相の消失半減期は約2時間及び約24時間であった。 また、1mg ×3回/日の反復投与において、血漿中濃度が定常状態に到達する日数は6～9日であると推定された。				
$T_{max}$	$C_{max}$	$T_{1/2}$	AUC	
ピソプール錠1mg： 3.1±0.8 hr (健康成人男子)	ピソプール錠1mg： 0.54±0.22 ng/mL (健康成人男子)	ピソプール錠1mg： 17.7±11.2 hr (健康成人男子)	ピソプール錠1mg： 5.48±1.80 ng·hr/mL (AUC <sub>0-∞</sub> ) (健康成人男子)	

併用	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子
禁忌	MAO阻害剤	発汗、不穏、全身痙攣、異常高熱、昏睡等があらわれるおそれがある。MAO阻害剤の投与を受けた患者にセチプチリンマレイン酸塩を投与する場合には、少なくとも2週間の間隔をおき、また、セチプチリンマレイン酸塩からMAO阻害剤に切り替えるときは、2～3日間の間隔をおくことが望ましい。	三環系抗うつ剤では、MAO阻害剤による抗うつ剤の代謝阻害及び抗うつ剤のモノアミン取込み阻害作用によるアドレナリン受容体感受性の増大等によりこれらの症状が発現すると考えられている。
注意	アルコール	中心系抑制作用↑(眠気、脱力感、怠感、ふらつき等)	相加作用
注意	降圧剤(クロニジン、guanfacin、guanabenz 等)	降圧剤の作用↓	$\alpha$ 2-アドレナリン受容体の拮抗作用。(セチプチリンは遮断、降圧薬は刺激)
注意	中枢神経抑制剤(フェニチジン誘導体、バルビツール酸誘導体等)	眠気、脱力感、怠感、ふらつき等があらわれやすい。	相互に中枢神経抑制作用を増強する。

一般名	商品名	本剤の代謝酵素	阻害する酵素	誘導する酵素
セルトラリン	ジェイノロフト	-	-	-
分類				
抗うつ薬				
効能・効果	用法・用量	高齢者へ投与時の影響	高齢者への投与方法	
うつ病・うつ状態、パニック障害	通常、成人にはセルトラリンとして1日25 mgを初期用量とし、1日100 mgまで漸増し、1日1回経口投与する。なお、年齢、症状により1日100 mgを超えない範囲で適宜増減する。	肝機能が低下している高齢者では、高い血中濃度が持続し、出血傾向の増強等がおこるおそれがある。	高齢者においては、肝機能、腎機能の低下を考慮し、用量等に注意して慎重に投与すること。	
<b>薬物動態</b>				
<ul style="list-style-type: none"> <li>・反復投与 健康成人男性(6例)にセルトラリン100 mgを1日1回10日間朝食後に反復経口投与した時の血中濃度は投与5日目は定常状態に達し、10日間の反復投与により理論値(R=2.0)を超える蓄積(投与1日目:Cmax40.5 ng/mL, AUC0-24 0.612 μg·hr/mL, 10日目:Cmax 69.9 ng/mL, AUC0-24 1.22 μg·hr/mL)は認められなかった。</li> <li>・高齢者 高齢うつ病患者(日本人、男性5例、女性8例、65歳以上)にセルトラリンを1日1回、最高6週間反復経口投与(25 mg/日から75 mg/日まで増量)した。高齢者のt<sub>1/2</sub>(男性30.7時間、女性35.7時間)は、健康成人男性の23.4時間と比較して長くなる傾向が認められた。</li> <li>・高齢者(外国人、男性11例、女性11例、65歳以上)及び成人(外国人、男性11例、女性11例、18~45歳)にセルトラリンを1日1回、30日間反復経口投与(50 mg/日から200 mg/日まで増量)した。成人男性の最終投与後のCmaxは117.5 ng/mLであり、高齢者(男性135.4 ng/mL、女性147.1 ng/mL)及び成人女性(165.6 ng/mL)に比べ、有意に低かったが、AUCにはいずれの群間でも有意な差は認められなかった。</li> <li>・腎機能障害患者(外国人データ) 腎機能障害患者(24例)にセルトラリン100 mgを食後に単回経口投与した時、セルトラリンの血中濃度は腎機能の障害により高くなる傾向を示したが、その上昇の程度は小さかった。</li> <li>・肝機能障害患者(外国人データ) 慢性非活動性肝不全患者(Child-Pughの分類A及びB、10例)にセルトラリン100 mgを単回経口投与した時の血中濃度推移は、健康成人と比較して、Cmaxが約1.7倍、AUC<sub>0-∞</sub>が4.4倍増加し、t<sub>1/2</sub>は2.3倍延長した。また、セルトラリン50 mgを肝機能障害患者(改訂Child-Pughの分類A及びB、10例)に21日間反復経口投与した時、単回投与時と同様の傾向が認められた。</li> <li>・乳汁中移行(外国人データ) 大うつ病を伴う授乳婦(26例)にセルトラリン25~200 mg(注)を1日1回、14日間以上反復経口投与した時、いずれの授乳婦の乳汁においてもセルトラリンは検出され、投与後9日目に最高値を示した。また、乳児の血清においてもセルトラリンが確認された。</li> </ul>				
T <sub>max</sub>	C <sub>max</sub>	T <sub>1/2</sub>	AUC	
50mg: 8.7±2.1 hr 100mg: 6.7±1.0 hr 200mg: 6.3±1.5 hr (n=6, 健康成人男性) (単回経口投与)	50mg: 15.1±4.3 ng/mL 100mg: 30.8±7.9 ng/mL 200mg: 90.8±15.0 ng/mL (n=6, 健康成人男性) (単回経口投与)	50mg: 22.5±8.1 hr 100mg: 24.1±7.9 hr 200mg: 23.4±6.2 hr (n=6, 健康成人男性) (単回経口投与)	50mg: 0.557±0.261 ng·hr/mL 100mg: 1.081±0.551 ng·hr/mL 200mg: 2.975±1.001 ng·hr/mL (n=6, 健康成人男性) (単回経口投与) (AUC <sub>0-∞</sub> )	

併用	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子
禁忌	MAO阻害剤(塩酸セレギリン(エフビー))	発汗、不穏、全身痙攣、異常高熱、昏睡等の症状があらわれることがある。なお、MAO阻害剤の投与を受けた患者に本剤を投与する場合、また本剤投与後にMAO阻害剤を投与する場合には、14日間以上の間隔をおくこと。	セロトニンの分解が阻害され、脳内セロトニン濃度が高まると考えられる。
禁忌	ビモジド	ビモジドのAUC↑、Cmax↑ ビモジドはQT延長を引き起こすことがあるので本剤と併用しないこと。	機序不明
注意	5-HT <sub>1B/1D</sub> 受容体作動薬(コハク酸スマトリブタン、ゾルミトリブタン、臭化水素酸エトレトリブタン)	脱力、反射亢進、協調運動障害、錯乱、不安、焦燥、興奮があらわれることがある。	相互に作用を増強させるおそれがある。
注意	レトリプトファンを含有する製剤(アミノ酸製剤、経腸成分栄養剤)	セロトニン作用が増強されるおそれがある。	レトリプトファンはセロトニンの前駆物質であるため、脳内セロトニン濃度が高まるおそれがある。
注意	アルコール	本剤投与中は、飲酒を避けることが望ましい。	他の抗うつ剤で作用の増強が報告されている。
注意	タマリシ系抗凝薬(ワルファリン)	ワルファリンのプロトロンビン反応時間AUCが軽度上昇(8%)したとの報告がある。本剤の投与を開始もしくは中止する場合は、プロトロンビン時間を慎重にモニターすること。	機序不明
注意	シメチジン	セルトラリンのAUC↑、Cmax↑、t <sub>1/2</sub> ↑	セルトラリンの代謝↓
注意	血糖降下薬(トルブタミド)	トルブタミドのグリアランスが減少(16%)したとの報告がある(4)。	血糖降下薬の代謝を阻害するためと考えられる。
注意	三環系抗うつ剤(クロミプラミン、イミプラミン、アミトリプチリン)	薬剤の血中濃度が上昇し、作用が増強されるおそれがある。	三環系抗うつ薬の代謝↓
注意	出血傾向が増強する薬剤(非定型抗精神病剤、フェノチアジン系薬剤、三環系抗うつ剤、アスピリン等の非ステロイド系抗炎症剤、ワルファリン等)	異常出血(鼻出血、胃腸出血、血尿等)が報告されているので、注意して投与すること。	SSRIによって血小板凝集能が阻害される。
注意	炭酸リチウム	セロトニンに関連した副作用(振戦等)が増大するおそれがある。	相加作用