

| 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 |
|---|--|---------------------------|-------------------------|--------|
| フルジアゼパム | エリスパシ | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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 | |
| 心身症(消化器疾患、高血圧症、心臓神経症、自律神経失調症)における身体症状並びに不安・緊張・抑うつ及び焦燥、易疲労性、睡眠障害 | フルジアゼパムとして1日0.75mgを3回に分け経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 | 運動失調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 | |
| 0.25mg : 1 hr (健常成人) | 0.25mg : 5.8±0.4ng/mL (健常成人) | 0.25mg : 約23 hr (健常成人) | - | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 |
|----|----------------------------------|---|---------|
| 注意 | 中枢神経抑制薬(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体、等) | 本剤の作用↓ 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)) | 本剤の作用↓ 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 | MAO阻害薬 | 本剤の作用↓ 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。 | 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 |
| フルタゾラム | コレミナル | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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 |
| 心身症(過敏性腸症候群、慢性胃炎、胃・十二指腸潰瘍)における身体症状ならびに不安・緊張・抑うつ | 1日12mgを3回に分経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 | | 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 | - | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| 12mg : 1 hr (n=5, 健康成人) | 12mg : 16 ng/mL (n=5, 健康成人) | 12mg : 3.5 hr (n=5, 健康成人) | - | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 |
|----|---------------------------------|------------------------------------|--|
| 注意 | 中枢神経抑制薬(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等) | 相互に作用↑ 減量するなど注意する。 | 相加作用 |
| 注意 | MAO阻害薬 | 相互に作用↑ 減量するなど注意する。 | 不明 |
| 注意 | アルコール((飲酒)) | 相互に作用↑ | 相加作用 |
| 注意 | 四環系抗うつ剤(マプロチリン塩酸塩等) | 併用中の本剤を急速に減量又は中止すると虚寒発作が起こるおそれがある。 | 本剤の抗虚寒作用が、四環系抗うつ剤による虚寒発作の発現を抑えている可能性がある。 |

| 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 |
|--|---|------------------|-------------------------|--------|
| フルトプラゼパム | レスタス | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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・抑うつ・易疲労性・睡眠障害 心身症(高血圧症、胃・十二指腸潰瘍、慢性胃炎、過敏性腸症候群)における身体症状ならびに不安・緊張・抑うつ・易疲労性・睡眠障害 | 1日2~4 mgを1~2回に分けて経口投与する。 年齢・症状により適宜増減。ただし高齢者には1日4mgまでとする。 | 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 | 健康人にフルトプラゼパムを経口投与した場合、血漿中には未変化体はほとんど認められず、主として活性代謝物であるN1位のデスアルキル体が存在し、その濃度は投与4~8時間後に最高値に達し、以後約190時間の半減期にて漸減した。健康人に連続経口投与した場合、血漿中のデスアルキル体濃度は投与開始10日目ごろより恒常状態に達し、神経症、心身症患者への長期連続投与(6~25ヵ月間)においても蓄積性は認められなかった。 | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| - | - | - | - | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 |
|----|---------------------------------|---|--|
| 注意 | 中枢神経抑制薬(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等) | 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 | 相加作用 |
| 注意 | MAO阻害薬 | 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 | 相加作用 |
| 注意 | アルコール(飲酒) | 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 | 相加作用 |
| 注意 | シメチジン | 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 | 本剤の血漿中濃度AUC↑消失半減期↓ |
| 注意 | オメプラゾール | 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 | 他のベンゾジアゼピン系化合物(ジアゼパム)のクリ |
| 注意 | 塩酸マプロチリン | (1)眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 (2)併用中の本剤を急速に減量又は中止すると痙攣発作が起こるおそれがある。 | (1)相互に中枢神経抑制作用を増強することが考えられる。 (2)本剤の抗痙攣作用により抑制されていた塩酸マプロチリンの痙攣誘発作用が本剤の減量・中止によりあらわれることが考えられている。 |
| 注意 | ダントロレンナトリウム | 筋弛緩作用↑ | 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 |
|---|---|---------|------------|---------------------------------|
| ヒドロキシジン | アタラックス、ジスロン、ハタナジン | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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 |
| 蕁麻疹、皮膚疾患に伴う・痒(蕁麻疹・皮膚炎、皮膚・痒症) 神経症における不安・緊張・抑うつ | 皮膚科領域には、1日30～60 mgを2～3回に分経口投与する。神経症における不安・緊張・抑うつには、1日75～150 mgを3～4回に分経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 | | - | 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 | | | | |
| - | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| - | - | - | - | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 |
|----|--------------------------------|--------------------------|---|
| 注意 | バルビツール酸誘導体(麻酔剤等の中枢神経抑制剤、剤) | 相互に作用↓ 減量するなど慎重に投与する。 | 相加 |
| 注意 | アルコール | 相互に作用↓ 減量するなど慎重に投与する。 | 相加 |
| 注意 | MAO阻害薬 | 相互に作用↓ 減量するなど慎重に投与する。 | 相加 |
| 注意 | ベタヒスチン(メリスロン) | ベタヒスチンの作用↓ | 本剤がベタヒスチンの作用と拮抗 |
| 注意 | 抗コリンエステラーゼ剤(臭化ネオスチグミン等) | 抗コリンエステラーゼ剤の作用↓ | 本剤が抗コリンエステラーゼ剤の作用と拮抗 |
| 注意 | シメチジン | 本剤の血中濃度↓ | シメチジンがCYP1A2、CYP2C19、CYP2D6、CYP3A4、CYP3A5を阻害し、本剤の代謝↓排泄↓ |
| 注意 | 不整脈を引き起こすおそれのある薬剤(コハク酸シベンズリン等) | 併用により心室性不整脈等 | ともに心血管系の副作用を起こすおそれがある。 |

| 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 |
|--|--|--|--|--------|
| ロフラゼン酸エチル | メイラックス、アストレム、ジメトックス、スカルナーゼ、メダタックス、ロンラックス | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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・抑うつ・睡眠障害 ・心身症(胃・十二指腸潰瘍、慢性胃炎、過敏性腸症候群、自律神経失調症)における不安・緊張・抑うつ・睡眠障害 | 2mgを1日1～2回に分けて経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 | 高齢者へ投与時の影響 運動失調等の副作用が現れやすい。 刺激興奮、錯乱(0.1%未満)等があらわれることがある。 | 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。異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。 | |
| 薬物動態 | | | | |
| 本剤は経口投与後速やかに吸収され、消化管通過時や肝によって初回通過効果を受け、未変化体は血中から検出されず、活性代謝物M-1(エチルエステル基が加水分解されたカルボン酸体)及びM-2(M-1の脱炭酸体)として血中に存在した。 | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| メイラックス錠剤2mg: 1.0±0.4 hr メイラックス細粒2mg: 1.2±0.5 hr (n=20, 健康成人) | メイラックス錠剤2mg: 130±24 ng/mL メイラックス細粒2mg: 121±23 ng/mL (n=20, 健康成人) | メイラックス錠剤2mg: 110±36 hr メイラックス細粒2mg: 110±35 hr (n=20, 健康成人) | メイラックス錠剤2mg: 5,970±1,474 ng·hr/mL メイラックス細粒2mg: 5,770±1,327 ng·hr/mL (n=20, 健康成人) | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 |
|----|---|------------------------------------|--|
| 注意 | 中枢神経抑制薬(フェノチアジン誘導体、塩酸クロロプロマジン等、バルビツール酸誘導体、フェノバルビタール等、等) | 相互に作用↑ | 相加 |
| 注意 | MAO阻害薬 | 相互に作用↑ | 不明 |
| 注意 | シメチジン | 本剤の作用↑ | 代謝↓により排泄↓、半減期↑、血中濃度↑ |
| 注意 | アルコール((飲酒)) | 本剤の作用↑ | 相加作用 アルコールの血中濃度が高い場合は代謝↓、クリアランス↓、半減期↑ |
| 注意 | 四環系抗うつ剤(塩酸マプロチリン等) | 併用中の本剤を急速に減量又は中止すると虚脱発作が起こるおそれがある。 | 本剤の抗虚脱作用が、四環系抗うつ剤による虚脱発作の発現を抑えている可能性がある。 |

| 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 |
|--|------------------------------------|-------------------------|-------------------------|--------|
| ロラゼパム | ワイパックス、アズロゲン、 ユーパシ、ロコスゲン | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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・抑うつ ・心身症(自律神経失調症、心臓神経症)における身体症状並びに不安・緊張・抑うつ | 1~3mgを2~3回に分けて経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 | 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 | | | | |
| - | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| 1.0mg：約 2 hr (健常成人) | - | 1.0mg：約 12 hr (健常成人) | - | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 |
|----|-------------------------------|---|---|
| 注意 | 中枢神経抑制薬(フェニチン誘導体、バルビツール酸誘導体等) | 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 | 相加作用 |
| 注意 | MAO阻害薬 | 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 | 相加作用 |
| 注意 | アルコール(飲酒) | 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 | 相加作用 |
| 注意 | マプロチリン塩酸塩 | (1) 眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下 (2) 併用中の本剤を急速に減量又は中止すると痙攣発作が起こるおそれがある。 | (1) 相互に中枢神経抑制作用を増強することが考えられる。 (2) 本剤の抗痙攣作用により抑制されていた塩酸マプロチリンの痙攣誘発作用が本剤の減量・ |
| 注意 | ダントロンナトリウム | 筋弛緩作用↑ | 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 |
|--|--|--|-------------------------|--------|
| メダゼパム | レスミット、メダゼパム | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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・抑うつ ・心身症(消化器疾患、循環器疾患、内分泌系疾患、自律神経失調症)における身体症状並びに不安・緊張・抑うつ | 1日10～30mgを経口投与する。 年齢・症状により適宜増減。 | 運動失調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 | | | | |
| メダゼパムの主活性代謝物のジアゼパムは0.5時間後から検出され、少なくとも48時間は低い濃度を維持した。同じくN-デスメチルジアゼパムは10.5～9時間後に出現し、24～72時間以上にわたってジアゼパムより血漿中濃度が高かった。 | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| 10mg : 0.5～1.5 hr (n=4, 健康成人(外国人)) 軽食2時間後単回経口投与 | 10mg : 0.14～0.26 μg/mL (n=4, 健康成人(外国人)) 軽食2時間後単回経口投与 | - | - | |
| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 | |
| 注意 | アルコール(中枢神経抑制薬、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↑ 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阻害薬 | 中枢神経抑制作用↑ 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 | シメチジン | 本剤の作用↑ | 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 |
|--|--|------------------|-------------------------|--------|
| メキサゾラム | メレックス | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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・抑うつ、易疲労性、強迫・恐怖・睡眠障害 ・心身症(胃・十二指腸潰瘍、慢性胃炎、過敏性腸症候群、高血圧症、心臓神経症、自律神経失調症)における身体症状ならびに不安・緊張・抑うつ・易疲労性・睡眠障害 | 1日1.5～3mgを3回に分けて経口投与する。年齢・症状により適宜増減。ただし、高齢者には1日1.5mgまでとする。 | 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 | | | | |
| 健康成人にメキサゾラムを経口投与して観察を行った結果によれば、メキサゾラムは消化管から吸収された後、代謝を受けてchlornordiazepam(CND)及びロラゼパムとして血中に存在することが確認されており、CNDは投与後1～2時間で最高血中濃度に達し、その後極めて緩徐に血中から消失し、ロラゼパム、CND又はベンゾフェノン型の代謝物として、尿中及び糞便中に排泄される。 | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| - | - | - | - | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 |
|----|---|--|---------|
| 注意 | 中枢神経抑制薬(フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体、(クロルプロマジン、フェノ、バルビタール等)) | 中枢神経抑制作用↑ 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 | 中枢神経抑制作用↑ 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阻害薬 | 本剤の作用↑ 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。 | 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 |
| オキサゼパム | ハイロング | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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 | 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 |
|--|---|------------------|-------------------------|--------|
| オキサゾラム | セレナール、トッカータ、ネブスン、ベルサール | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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 | |
| ・神経症における不安・緊張・抑うつ・睡眠障害 ・心身症(消化器疾患、循環器疾患、内分泌疾患、自律神経失調症)における身体症状ならびに不安・緊張・抑うつ ・麻酔前投薬 | 1. 1回10～20mg、1日3回経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 2. 麻酔前投薬の場合には、通常オキサゾラムとして1～2mg/kgを就寝前又は手術前に経口投与する。年齢・症状・疾患により適宜増減。 | 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 | | | | |
| 健康成人7例を対象としてオキサゾラム20mgを空腹時1回経口投与後の血中ならびに尿中代謝物を主として高速液体クロマトグラフィーにより測定した。その結果、オキサゾラムの未変化体の血中・尿中濃度はいずれも定量感度以下(8ng/mL以下)であった。主代謝物としてN-desmethyldiazepamが検出されており、また、尿中主代謝物は2-amino-5-chloro-4-hydroxybenzophenone (ACHB)ならびにその抱合体及び2-amino-5-chlorobenzophenone (ACB)である。 | | | | |
| Tmax | Cmax | TI/2 | AUC | |
| - | - | - | - | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 |
|----|---|--|---------|
| 注意 | 中枢神経抑制薬(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)、アルコール) | 中枢神経抑制作用↑ 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阻害薬 | 本剤の作用↑ | 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 |
|--|--|----------------------------|-------------------------|--------|
| プラゼバム | ゼダبران、レスタス | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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・抑うつおよび睡眠障害 ・うつ病における不安・緊張および睡眠障害 ・心身症(消化器疾患、高血圧症、自律神経失調症)における身体症状並びに不安・緊張・抑うつおよび睡眠障害 ・麻酔前投薬 | 1. 10～15mgを1日1回、または10～20mgを1日2～3回に分けて経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 2. 麻酔前投薬の場合は、1回15mg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。 | 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 | | | | |
| 健康成人男子に連続経口投与(1回10mg、1日2回、15日間)した時、デスアルキルプラゼバムの血漿中濃度は投与後6～9日でプラトーに達する。投与中止後の薬物の血中からの消失は速やかで、1回投与の場合と連続投与の場合と同じ推移を示す。 | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| - | - | 20mg単回投与：94 hr (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 | 中枢神経抑制薬(フェニチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体、) | 中枢神経抑制作用↑ | 相加作用 |
| 注意 | MAO阻害薬 | 中枢神経抑制作用↑ | 相加作用 |
| 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 | 本剤の作用↓ | 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 |
|---|--|--|---|--------|
| タンドスピロン | セディール | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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 | |
| ・心身症(自律神経失調症、本態性高血圧症、消化性潰瘍)における身体症状ならびに抑うつ、不安、焦躁、睡眠障害 ・神経症における抑うつ、恐怖 | 1日30mgを3回に分け経口投与する。年齢・症状により適宜増減し、1日60mgまでとする。 | - | 外国における高用量(90mg/日)を用いた体内薬物動態試験で高齢者では若年者に比べ高い血中濃度を示したので、高齢者では低用量(例えば1日15mg)から投与を開始するなど注意すること。 | |
| 薬物動態 | | | | |
| 健康成人に1回10mg、1日3回、5日間連続経口投与した場合、投与開始後、1、3及び5日目の血清中未変化体濃度は単回投与時と同様の推移を示し、投与休止により速やかに消失し、蓄積性は認められなかった。 心身症及び神経症患者に30又は60mg/日を連続経口投与した場合、血清中未変化体濃度は健康人と同様の推移を示し、蓄積性はないと考えられた。 食事による影響はほとんど認められなかった。 | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| 20mg食後: 0.8±0.1 hr 20mg絶食時: 1.4±0.3 hr (n=6, 健康成人) | 20mg食後: 3.2±0.6 ng/mL 20mg絶食時: 2.9±0.7 ng/mL (n=6, 健康成人) | 20mg食後: 1.2 hr 20mg絶食時: 1.4 hr (n=6, 健康成人) | 20mg食後: 8.2±2.1 ng·hr/mL 20mg絶食時: 1.5±3.1 ng·hr/mL (n=6, 健康成人) | |
| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状 | 機序・危険因子 | |
| 注意 | ブチロフェノン系薬剤(ハロペリドール、プロムペリドール、スピペロン等) | 錐体外路症状↑ | 本剤の弱い抗ドーパミン作用による | |
| 注意 | カルシウム拮抗剤(ニカルジピン、アムロジピン、ニフェジピン等) | 降圧作用↑ | 本剤のセロトニン受容体を介した中枢性の血圧降下作用による | |
| 注意 | セロトニン再取り込み阻害作用を有する薬剤(フルボキサミン、パロキセチン、ミルナシプラシ、トラゾドン等) | セロトニン症候群があらわれることがある。 | 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 |
|--|---|---|--|--------|
| トフィゾパム | グランダキシシ、エンマダキシシ、クラソバシ、ダランバム、ダースペン、コバンダキシシ、ツルバール、トフィー | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗不安薬 | | | | |
| 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 | |
| 下記疾患における頭痛・頭重、怠感、心悸亢進、発汗等の自律神経症状、自律神経失調症、頭部・頸部損傷、更年期障害・閉経欠落症状 | 1回50mg、1日3回経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 | - | 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 | | | | |
| 健康成人男子に本剤を経口投与したところ、投与1時間後には最高血中濃度に達し、以後漸減して12時間後には血中からほぼ消失した。 | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| トルバナシシ錠50mg： 1.00±0.00 hr (健康成人男子) (空腹時単回経口投与) | トルバナシシ錠50mg： 28.57±5.78 ng/mL (健康成人男子) (空腹時単回経口投与) | トルバナシシ錠50mg： 4.26±2.44 hr (健康成人男子) (空腹時単回経口投与) | トルバナシシ錠50mg： 77.61±16.9 ng·hr/mL (健康成人男子) (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(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↑ | 相加作用 |
| 注意 | アルコール | 中枢神経抑制作用↑ | 相加作用 |
| 注意 | タクロリムス水和物 | タクロリムスの作用↑ 本剤を減量又は休薬する等適切な処置を行う。 | 本剤がCYP3A4を阻害し、タクロリムスの代謝↓ 血中濃度↑ |

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

4. 抗精神病薬

| 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 |
|---|--|--|---|-------------------------------------|
| フロムベリドール | プリンドリル、インプロメン、フロムベリドール、プリベリドール、メルカイク、ルナプロロン | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗精神病薬 | | | | |
| 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 | 1日3～18mgを経口投与する。年齢・症状により適宜増減し、1日36mgまで増量可。 | | 錐体外路症状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 | - | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| ルナプロロン錠1mg×3錠： 5.0±0.5 hr (Mean±SE, n=16, 健康成人男子) | ルナプロロン錠1mg×3錠： 0.531±0.066 ng/mL (Mean±SE, n=16, 健康成人男子) | ルナプロロン錠1mg×3錠： 24.1±1.9 hr (Mean±SE, n=16, 健康成人男子) | ルナプロロン錠1mg×3錠： 11.781±1.467 ng·hr/mL (AUC0→72) (Mean±SE, n=16, 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 | アドレナリン(ホスミン) | 重篤な血圧降下 | 本剤のα受容体遮断作用により、β受容体刺激作用が優位となり、血圧降下作用が増強される。 |
| 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↓ 減量するなど注意する。 | 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 | リチウム | 類似化合物(ハロベリドール)でリチウムとの併用により心電図変化、重症の錐体外路症状、持続性のジスキネジア、突発性の悪性症候群、非可逆性の脳障害 観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止する。 | 機序不明 |
| 注意 | 抗コリン作用を有する薬剤(抗コリン作動性抗パーキンソン剤、フェノチアジン系化合物、三環系抗うつ剤等) | 抗コリン系の副作用↑(腸管麻痺等)、精神症状の悪化 | 相加作用 |
| 注意 | メクロプラミド | 内分泌機能異常、錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | ドンペリドン | 内分泌機能異常、錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | タンドスピロン | 錐体外路症状↑ | 相加作用 |
| 注意 | ドパミン作動薬(レボドパ製剤、プロモクリプテン、メシル酸塩等) | ドパミン作動薬の作用↓ | 拮抗作用 |
| 注意 | カルバマゼピン | 本剤の作用↓ | 薬物代謝酵素誘導作用により、本剤の血中濃度↓ |

| 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 |
|---------------------------|--|-------------------------|----------------------|-------------------------------------|
| カルピプラミン | デフェクトン | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗精神病薬 | | | | |
| 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 |
| 意欲減退、抑うつ、心気を主症状とする慢性統合失調症 | 他の抗精神病薬の効果が不十分な場合に、付加して使用する。 1日75～225mgを3回に分割経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 | | 錐体外路症状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 | | | | |
| - | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| - | - | ラット：0.9 hr 家兎：2.3 hr | - | |

| 併用禁忌 | 併用薬剤名 | 臨床症状・対処 | 機序・危険因子 |
|------|-------------------------------|---|--|
| 注意 | アドレナリン(ボスミン) | 重篤な血圧降下 | 本剤の α 受容体遮断作用により、 β 受容体刺激作用が優位となり、血圧降下作用が増強される。 |
| 注意 | 中枢神経抑制剤(バルビツール酸誘導体・麻酔剤等) | 睡眠(催眠)・精神機能抑制作用↑ 麻酔効果↓、血圧↓等 減量するなど慎重に投与する。 | 相加作用 |
| 注意 | アルコール(飲酒) | 眠気、精神運動機能↓ | 相加作用 |
| 注意 | ドンパリドン | 内分泌機能調節異常又は錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | メクロプラミド | 内分泌機能調節異常又は錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | リチウム | 心電図変化、重症の錐体外路症状、持続性のジスキネジア、突発性の悪性症候群、非可逆性の脳障害 観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止する。 | 機序は不明であるが、併用による抗ドパミン作用の増強等が考えられている。 |
| 注意 | ドパミン作動薬(レボドパ製剤、プロモクリプチンメシル酸塩) | 相互に作用↓ | 拮抗作用 |

| 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 |
|---|--|---------------------------------------|--|--------|
| クロルプロマジン | ウインタミン、コントミン、ベグタミン、塩酸クロルプロマジン | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗精神病薬 | | | | |
| 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、躁病、神経症における不安・緊張・抑うつ、悪心・嘔吐、吃逆、破傷風に伴う虚寒、麻酔前投薬、人工冬眠、催眠・鎮静・鎮痛剤の効力増強 | 1日30～100mgを分割経口投与する。精神科領域において用いる場合には、1日50～450mgを分割経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 | 起立性低血圧、錐体外路症状、脱力感、運動失調、排泄障害等が起こりやすい。 | 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 | | | | |
| 単回経口投与したときの薬物動態 (測定法:ガスクロマトグラフィー) | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| 100mg: 2～3 hr (n=8, 精神病患者女子(外国人)) | - | 100mg: 30.5 hr (n=8, 精神病患者女子(外国人)) | 100mg: 838.0 ± ∞ ng·hr/mL (n=8, 精神病患者女子(外国人)) | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状・対処 | 機序・危険因子 |
|----|-----------------------------------|--|---|
| 禁忌 | アドレナリン(ボスミン) | 重篤な血圧降下 | 本剤のα受容体遮断作用により、β受容体刺激作用が優位となり、血圧降下作用が増強される。 |
| 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↑ 減量するなど慎重に投与する。なお、バルビツール酸誘導体等の抗痙攣作用は、フェニチアジン系薬剤との併用によっても増強されることはない。この場合抗痙攣剤は減量してはならない。 | 相加作用 |
| 注意 | アルコール | 中枢神経抑制作用↑ | 相加作用 |
| 注意 | 降圧剤 | 血圧↓ 減量するなど慎重に投与する。 | 相加作用 |
| 注意 | 抗コリン作用を有する薬剤(原文:「アトロピン様作用を有する薬剤」) | 抗コリン作用↑ 減量するなど慎重に投与する。 | 相加作用 |
| 注意 | リチウム | 心電図変化、重症の錐体外路症状、持続性のジスキネジア、突発性の悪性症候群、非可逆性の脳障害 観察を十分に行い、慎重に投与する。なお、このような症状があらわれた場合には投与を中止する。 | 機序は不明 |
| 注意 | ドンペリドン | 内分泌機能調節異常又は錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | メクロプラミド | 内分泌機能調節異常又は錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | ドパミン作動薬(レボドパ製剤、プロモクリプチンメシル酸塩) | 相互に作用↓ | 拮抗作用 |

| 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 |
|---|---|---|--|--------|
| クロカブラミン | クロフェクトン、パドラセン | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗精神病薬 | | | | |
| 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 | 1日30～150mgを3回に分けて経口投与する。症状・年齢に応じて適宜増減。 | 高齢者では錐体外路症状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 | | | | |
| | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| クロカブラミン錠50mg単回投与： 2.7±1.2 hr (mean±SD, n=3, 健康成人) | クロカブラミン錠50mg単回投与： 12.9±3.3 ng/mL (mean±SD, n=3, 健康成人) | クロカブラミン錠50mg単回投与： 46±6 hr (mean±SD, n=3, 健康成人) | クロカブラミン錠50mg単回投与： 436±257 ng·h/mL (mean±SD, n=3, 健康成人) | |
| パドラセン錠25mg： 1.4±0.5 hr パドラセン顆粒10%0.25g： 1.4±0.5 hr | パドラセン錠25mg： 5.12±1.71 ng/mL パドラセン顆粒10%0.25g： 5.56±1.81 ng/mL | パドラセン錠25mg： 41.57±36.59 hr パドラセン顆粒10%0.25g： 43.32±45.12 hr | パドラセン錠25mg： 74.93±36.91 ng·hr/mL パドラセン顆粒10%0.25g： 82.45±56.40 ng·hr/mL (AUC0→72) | |
| (Mean±SD, n=16, 健康成人男子) (絶食単回経口投与) | (Mean±SD, n=16, 健康成人男子) (絶食単回経口投与) | (Mean±SD, n=16, 健康成人男子) (絶食単回経口投与) | (Mean±SD, n=16, 健康成人男子) (絶食単回経口投与) | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状・対処 | 機序・危険因子 |
|----|---------------------------------|--|---|
| 禁忌 | アドレナリン(ポスミン) | 重篤な血圧降下 | 本剤のα受容体遮断作用により、β受容体刺激作用が優位となり、血圧降下作用が増強される。 |
| 注意 | 中枢神経抑制剤((バルビツール酸誘導体・麻酔剤等)) | 睡眠(催眠)・精神機能抑制作用↑麻酔効果↑、血圧↓等 減量するなど慎重に投与する。 | 相加作用 |
| 注意 | アルコール((飲酒)) | 眠気、精神運動機能↓ | 相加作用 |
| 注意 | ドンペリドン | 内分泌機能調節異常又は錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | メトクロプラミド | 内分泌機能調節異常又は錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | リチウム | 心電図変化、重症の錐体外路症状、持続性のジスキネジア、突発性の悪性症候群、非可逆性の脳障害 観察を十分に行い、慎重に投与する。なお、このような症状があらわれた場合には投与を中止する。 | 機序は不明 |
| 注意 | ドパミン作動薬((レボドパ製剤、プロモクリップチンメルシド)) | 相互に作用↓ | 拮抗作用 |

| | | | | |
|--------|--|---------|----------------|-------------------------|
| 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 |
| フロピドヒド | プロピタン | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗精神病薬 | | | | |
| 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 | 最初の1～2週間は1日50～150mg、以後漸増し、1日150～600mgを3回に分けて経口投与する。 年齢・症状により適宜増減。 | | 薬体外路症状が起こりやすい。 | 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 | |
| - | - | - | - | |

| 併用 | 併用薬剤名 | 臨床症状・対処 | 機序・危険因子 |
|----|----------------------|--------------------------|--|
| 禁忌 | アドレナリン(ボスミン) | 重篤な血圧降下 | 本剤の α 受容体遮断作用により、 β 受容体刺激作用が優位となり、血圧降下作用が増強される。 |
| 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↓ 減量するなど注意する。 | 相加作用 |
| 注意 | アルコール | 相互に作用↑ 用量を調節するなど注意する。 | 相加作用 |
| 注意 | タンドスピロンクエン酸塩 | 薬体外路症状↑ | 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 |
|---------|-------------------------------------|--------------------------------------|------------------------|--------|
| フルフェナジン | フルメジン | - | - | - |
| 分類 | | | | |
| 抗精神病薬 | | | | |
| 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 | 1日1~10mgを分割経口投与する。 年齢・症状により適宜増減。 | 起立性低血圧、錐体外路症状、脱力感、運動失調、排泄障害等が起こりやすい。 | 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 | | | | |
| - | | | | |
| Tmax | Cmax | T1/2 | AUC | |
| - | - | - | - | |

| 併用禁忌 | 併用薬剤名 | 臨床症状・対処 | 機序・危険因子 |
|------|-----------------------------------|--|--|
| | アドレナリン(ボスミン) | 重篤な血圧降下 | 本剤の α 受容体遮断作用により、 β 受容体刺激作用が優位となり、血圧降下作用が増強される。 |
| 注意 | 中枢神経抑制剤((バルビツール酸誘導体・麻酔剤等)) | 睡眠(催眠)・精神機能抑制作用↑麻酔効果↑、血圧↓等 減量するなど慎重に投与する。 | 相加作用 |
| 注意 | 降圧剤 | 起立性低血圧等 減量するなど慎重に投与する。 | 相加作用 |
| 注意 | 抗コリン作用を有する薬剤(原文:「アトロピン様作用を有する薬剤」) | 抗コリン作用↑(口渇、眼圧上昇、排泄障害、頻尿、腸管麻痺等) 減量するなど慎重に投与する。 | 相加作用 |
| 注意 | アルコール((飲酒)) | 眠気、精神運動機能↓ | 相加作用 |
| 注意 | ドンペリドン | 内分泌機能調節異常又は錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | メトクロプラミド | 内分泌機能調節異常又は錐体外路症状 | 相加作用 |
| 注意 | リチウム | 心電図変化、重症の錐体外路症状、持続性のジスキネジア、突発性の悪性症候群、非可逆性の脳障害 観察を十分に行い、慎重に投与する。なお、このような症状があらわれた場合には投与を中止す | 機序は不明 |
| 注意 | ドパミン作動薬((レボドパ製剤、プロモクリプチンメシル酸塩)) | 相互に作用↓ | 拮抗作用 |