

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)における身体症候ならびに抑うつ、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

健常成人に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常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, 健常成人)	20mg食後： 3.2±0.6 ng/mL 20mg絶食時： 2.9±0.7 ng/mL (n=6, 健常成人)	20mg食後： 1.2 hr 20mg絶食時： 1.4 hr (n=6, 健常成人)	20mg食後： 8.2±2.1 ng·hr/mL 20mg絶食時： 1.5±3.1 ng·hr/mL (n=6, 健常成人)

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بران、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
トフィソバム	グランダキシシ、エンマダキシシ、クラソパン、グランバム、ゲースパン、コバンダキシシ、ツルベール、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・卵巣欠落症状	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	
トルバナシン錠50mg： 1.00±0.00 hr (健康成人男子) (空腹時単回経口投与)	トルバナシン錠50mg： 28.57±5.78 ng/mL (健康成人男子) (空腹時単回経口投与)	トルバナシン錠50mg： 4.26±2.44 hr (健康成人男子) (空腹時単回経口投与)	トルバナシン錠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
<b>フロムペリドール</b>	ブリンドリル、インプロメン、フロムペリドール、プリペリドール、メルカイック、ルナプロン	-	-	-
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	
ルナプロン錠1mg×3錠： 5.0±0.5 hr  (Mean±SE, n=16, 健康成人男子)	ルナプロン錠1mg×3錠： 0.531±0.066 ng/mL  (Mean±SE, n=16, 健康成人男子)	ルナプロン錠1mg×3錠： 24.1±1.9 hr  (Mean±SE, n=16, 健康成人男子)	ルナプロン錠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(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((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(ハロペリドール)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、プロモクリプチン、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	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 $\alpha$ 受容体遮断作用により、 $\beta$ 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、ベゲタミン、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、破傷風に伴う痙攣、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)	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ため、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	パドラセン錠25mg： 5.12±1.71 ng/mL	パドラセン錠25mg： 41.57±36.59 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： 1.4±0.5 hr	パドラセン顆粒10%0.25g： 5.56±1.81 ng/mL	パドラセン顆粒10%0.25g： 43.32±45.12 hr	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(ボスミン)	重篤な血圧低下	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、血圧低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
フロロピバミド	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。		錐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 $\alpha$ 受容体遮断作用により、 $\beta$ 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	錐体外路症状↑	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
禁忌	アドレナリン(ボスミン)	重篤な血圧降下	本剤の $\alpha$ 受容体遮断作用により、 $\beta$ 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、排尿障害、頻脈、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

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
デカン酸フルフェナジン	フルデカシン	-	-	-
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回12.5mg～75mgを4週間隔で筋肉内注射する。 薬量及び注射間隔は病状又は本剤による随伴症状の程度に応じて適宜増減並びに間隔を調節する。 初回用量は、可能な限り少量より始め、50mgを超えないものとする。	錐体外路症状、脱力感、運動失調、排泄障害が起こりやすい。	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				
<p>血漿中濃度 統合失調症患者(6例)にデカン酸フルフェナジン(FD)25mgを1回筋肉内投与後の血漿中フルフェナジン濃度は、1日目で降0.12～0.64ng/mLで推移し、投与後28日目には0.15～0.21ng/mLを示した。また、4週間隔で投与した連続投与試験では、血漿中フルフェナジン濃度は個体差はあるものの5回投与でほぼプラトーに達した。12回にわたる長期投与例においてもプラトーに達した後は血漿中濃度の上昇傾向は認められなかった。</p>				
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
禁忌	アドレナリン(ボスマン)	重篤な血圧降下	本剤の $\alpha$ 受容体遮断作用により、 $\beta$ 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、排尿障害、頻脈、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
<b>ハロペリドール</b>	セレネース、リントン、ハロペリドール、エセックチン、スイロリン、ハロジャスト、ハロスデン、ハロミドール、ヨウベリドール、ハロメチン	-	-	-
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	1日0.75～2.25mgから始め、徐々に増量する。維持量として1日3～6mgを経口投与する。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	
10mg : 5.1±1.0 hr (mean±SD, n=7, 健康成人)	10mg : 3.2±1.2 ng/mL (mean±SD, n=7, 健康成人)	10mg : 24.1±8.9 hr (mean±SD, n=7, 健康成人)	10mg : 103.5±23.9 ng・hr/mL (mean±SD, n=7, 健康成人)	

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 $\alpha$ 受容体遮断作用により、 $\beta$ 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	中枢神経抑制作用↑	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	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	抗ドパミン作用を有する薬剤(ベンザミド系薬剤、メクロプラミド、スルピリド、チアプリド、ドンペリドン等)	内分泌機能調節異常又は錐体外路症状	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、プロモクリプチン等)	相互に作用↓	拮抗作用
注意	薬物代謝酵素(主にCYP3A4)を誘導する薬剤(カルバマゼピン、リファンピシン等)	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
<b>デカン酸ハロペリドール</b>	ネオペリドール、ハロマンズ	-	-	-
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回量50mg～150mgを4週間隔で筋肉内投与する。投薬量、注射間隔は症状に応じて適宜増減ならびに間隔を調節する。なお、初回用量は、経口ハロペリドールの1日用量の10～15倍を目安とし、可能な限り少量より始め、100mgを超えないものとする。		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				
単回投与 本剤100mg(ハロペリドール当量)を筋肉内投与した場合のハロペリドールの血清中濃度の推移及び薬物速度論的パラメータは下記のとおりである。なお、いずれの時点においても未変化体(ハロペリドールデカン酸エステル)は血清中に検出されなかった。 (100mg筋肉内投与時)				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
100mg : 5～14 day (n=6, 統合失調症患者)	100mg : 1.0～3.8 ng/mL (n=6, 統合失調症患者)	100mg : 27.2 day (n=6, 統合失調症患者)	100mg : 99 ng・day/mL (AUC <sub>0～∞</sub> ) (n=6, 統合失調症患者)	

併用禁忌	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 $\alpha$ 受容体遮断作用により、 $\beta$ 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)	中枢神経抑制作用が増強↑	相加作用
注意	アルコール	中枢神経抑制作用が増強↑	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	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	抗ドパミン作用を有する薬剤(ベンザミド系薬剤、メクロプラミド、スルピリド、チアプリド等、ドンペリドン等)	内分泌機能調節異常又は錐体外路症状	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、プロモクリプチン等)	相互に作用↓	拮抗作用
注意	薬物代謝酵素(主にCYP3A4)を誘導する薬剤(カルバマゼピン、リファンピシン等)	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
<b>レボプロマジン</b>	ヒルナミン、レボトミン、ソフミン	-	-	-
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, うつ病における不安・緊張	経口薬: 1日25~200mgを分割経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 注射: 1回25mgを筋肉内注射。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	
50mg内服: 1~4 hr (n=5, 精神病患者男子) 100mg内服: 1.9(1.0~5.0) hr (n=12, 健康成人(外国人)) 25mg筋注: 0.88±0.48 hr (n=4, 精神病患者男子(外国人))	50mg内服: 16~40 ng/mL (n=5, 精神病患者男子) 100mg内服: 49.2(24.0~107.0) ng/mL (n=12, 健康成人(外国人)) 25mg筋注: 26.3±3.0 ng/mL (n=4, 精神病患者男子(外国人))	50mg内服: 15~30 hr (n=5, 精神病患者男子) 100mg内服: 14.2(8.9~27.0) hr (n=12, 健康成人(外国人)) 25mg筋注: 20.7±6.2 hr (n=4, 精神病患者男子(外国人))	50mg内服: (AUC0-∞) 140~800 ng·hr/mL (n=5, 精神病患者男子) 100mg内服: 372.3(123~1314) ng·hr/mL (n=12, 健康成人(外国人)) 25mg筋注: (AUC0-∞) 419.4±72.2 ng·hr/mL (n=4, 精神病患者男子(外国人))	

併用禁忌	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)	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)	相互に中枢神経抑制作用↑ 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、フェノ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	相互に中枢神経抑制作用↑	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
モベロン	ルバトレン	-	-	-
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10～15mgより投与を始め症状に応じて漸増し、1日20～30mgを症状が改善するまで継続投与する。その後維持量として10～15mgを投与する。 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				
-				
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
禁忌	エピネフリン	血圧降下	本剤の $\alpha$ 受容体遮断作用により、 $\beta$ 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。
禁忌	テルフェナジン	QT延長、心室性不整脈	機序不明
禁忌	アステミゾール	QT延長、心室性不整脈	機序不明
注意	中枢神経抑制剤(バルビツール酸誘導体等)	相互に中枢神経抑制作用↑ 用量を調節するなど注意する。	相加作用
注意	アルコール(飲酒)	相互に中枢神経抑制作用↑	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
モサプラミン	クレミン	-	-	-
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。 年齢・症状により適宜増減し、1日300mgまで増量可。		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	
25mg : 6.0 ± 1.4 hr (mean ± SD, n=5, 健康成人)	25mg : 7.9 ± 1.7 ng/mL (mean ± SD, n=5, 健康成人)	25mg : 15 ± 2 hr (mean ± SD, n=5, 健康成人)	(AUC0~∞) 25mg : 168 ± 23 ng·h/mL (mean ± SD, n=5, 健康成人)	

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))	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
ネモナプリド	エミレース	-	-	-
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9～36mgを食後に分割経口投与する。 年齢・症状により適宜増減し、1日60mgまで増量可。	肝機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがある。	低用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	
3mg:2.33 hr 6mg:2.17 hr (n=6, 健康成人)	3mg:0.77 ng/mL 6mg:1.18 ng/mL (n=6, 健康成人)	3mg:4.5 hr 6mg:2.3 hr (n=6, 健康成人)	(AUC0-10h) 3mg:2.85 ng・h/mL 6mg:3.69 ng・h/mL (n=6, 健康成人)	
併用	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子	
注意	中枢神経抑制剤(ノルビツール酸誘導体等), ペントバルビタール, ナトリウム等)	中枢神経抑制作用↑ 必要に応じ本剤を減量する。	相加作用	
注意	アルコール(飲酒)	中枢神経抑制作用↑ 必要に応じ本剤を減量する。	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
オランザピン	ジプレキサ	-	-	-
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	5~10mgを1日1回経口投与により開始する。維持量として1日1回10mg経口投与する。 年齢・症状により適宜増減。ただし、1日量は20mgを超えないこと。		-	高齢者は一般的に生理機能が低下しており、また、本剤のクリアランスを低下させる要因であるので、慎重に投与すること。本剤のクリアランスを低下させる他の要因(非喫煙者、女性等)を併せ持つ高齢者では、2.5~5mgの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。[本剤のクリアランスを低下させる他の要因を併せ持つ高齢者では本剤のクリアランスが低下していることがある。]

薬物動態

(外国人での成績)

オランザピンカプセルを投与したとき、患者の血漿中濃度は、2.5~20mgの範囲において投与量比例的であり、薬物動態の線形性が確認された。健康成人では、平均消失半減期は33時間(20.7~54.1時間:5~95パーセンタイル)であり、見かけのクリアランスは平均26.1L/hr(12~47L/hr:5~95パーセンタイル)である。1週間以内に定常状態に達する。

高齢者:オランザピンカプセルの単回投与では65歳以上の被験者16例の消失半減期は非高齢者に比し53%延長した(高齢者:52時間、非高齢者:34時間)。14日間連続投与では、65歳以上の被験者8例の消失半減期は59時間であった。

Tmax	Cmax	T1/2	AUC
5mg錠×1錠: 4.8±1.2 hr (健康成人男子) 口腔内崩壊錠5mg×1錠: 3.8±1.1 hr (健康成人男子) 普通錠5mg×1錠: 3.4±1.0 hr (健康成人男子)	5mg錠×1錠: 10.5±2.2 ng/mL (健康成人男子) 口腔内崩壊錠5mg×1錠: 10.2±1.7 ng/mL (健康成人男子) 普通錠5mg×1錠: 10.9±2.8 ng/mL (健康成人男子)	5mg錠×1錠: 28.5±6.1 (健康成人男子) 口腔内崩壊錠5mg×1錠: 30.5±5.5 hr (健康成人男子) 普通錠5mg×1錠: 31.2±5.4 hr (健康成人男子)	(AUC0-96) 5mg錠×1錠: 279±86.6 ng·hr/mL (健康成人男子) 口腔内崩壊錠5mg×1錠: 260±58.7 ng·hr/mL (健康成人男子) 普通錠5mg×1錠: 259±72.0 ng·hr/mL (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	エピネフリン(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	中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	抗コリン作用を有する薬剤(抗コリン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)	相加作用
注意	ドパミン作動薬(レボドパ製剤)	相互に作用↓	拮抗作用
注意	フルボキサミン	本剤の作用↑ 本剤を減量するなど注意する。	CYP1A2阻害作用により、本剤のクリアランス↓、血中濃度↑
注意	シプロフロキサシン	本剤の作用↑	CYP1A2阻害作用により、本剤のクリアランス↓、血中濃度↑
注意	カルバマゼピン	本剤の作用↓	CYP1A2誘導作用により、本剤のクリアランス↑、血中濃度↓
注意	オメプラゾール	本剤の作用↓	CYP1A2誘導作用により、本剤のクリアランス↑、血中濃度↓
注意	リファンピシン	本剤の作用↓	CYP1A2誘導作用により、本剤のクリアランス↑、血中濃度↓
注意	喫煙	本剤の作用↓	CYP1A2誘導作用により、本剤のクリアランス↑、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
オキシペルテン	ホーリット	-	-	-
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1回20mgを1日2～3回経口投与し、漸次増量して1回40～80mgを1日2～3回経口投与する。場合により1回100mgを1日3回経口投与する。年齢・症状により適宜増減。 40mg錠は上記の用法・用量のうち、漸次増量時以降に使用する。		0	一般に高齢者では生理機能が低下しているため少量から投与を開始するなど注意すること。
薬物動態				
150mg, 180mg, 210mgを1日3分服として6週間連続投与した場合、血清中濃度は7日以内に定常状態に達した。				
Tmax	Cmax	T1/2	AUC	
個人差有り。50mg, 60mg, 70mgをそれぞれ経口投与した場合30分内となる群と4時間目までに徐々に血中濃度が上昇していく群とがある。(n=6, 統合失調症患者)	50mg, 60mg, 70mg : 200～300ng/mL (30分以内に血中濃度が上昇する群では、約400ng/mL)	-	-	
併用注意	併用薬剤名	臨床症状・対処	機序・危険因子	
	MAO阻害剤	中枢神経系の興奮および心悸亢進、血圧上昇など	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
ペロスピロン	ルーラン	-	-	-
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回4 mg 1日3回より始め、徐々に増量する。維持量として1日12~48mgを3回に分けて食後経口投与する。年齢・症状により適宜増減。但し、1日量は48mgを超えないこと。	錐体外路症状等の副作用があらわれやすい。	高齢者では一般に生理機能が低下しており、動物実験(ラット)で老齢動物、肝障害及び腎障害モデル動物において血清中濃度の増大等が認められているので、少量(1回4mg)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

健康成人にペロスピロン1, 2, 4及び8mgを単回経口投与したとき、血清中ペロスピロン濃度の最高値は投与後0.5~4時間に認められ、その濃度(Cmax)は投与量に対応して上昇した。

健康成人に1日1回4mgを3日間反復経口投与したとき、血清中ペロスピロンのCmax、AUC及びt1/2は投与1日目と3日目で大差なく、反復投与により、上昇や低下あるいは生物学的半減期の変化はないと考えられた。

健康成人に1回2mgを経口投与したとき、食後投与におけるCmax及びAUCはそれぞれ絶食下投与の1.6倍及び2.4倍となった。

後期第II相試験で患者に1回4~32mg、1日用量として12~96mgを4週間あるいは8週間反復投与したとき、血清中ペロスピロンの濃度を同投与量で比較すると投与開始後4週目と8週目で大差なく、また、血清中ペロスピロン濃度の平均値は用量依存的に上昇する傾向を示した。第I相臨床試験における健康人の反復投与で示唆されたように、患者での長期投与においても蓄積性を示唆する血中濃度の変動はないと考えられた。

Tmax	Cmax	T1/2	AUC
8mg : 1.4 ~ 2.3 hr (健康成人)	8mg : 2.2 ~ 5.7 ng/mL (健康成人)	8mg : α相 : 1~3 hr β相 : 5~8 hr (健康成人)	8mg : 10.1~15.7 ng·hr/mL (健康成人)

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)	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))	相互に中枢神経抑制作用↑ 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、フェノ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ため、この場合抗痙攣剤は減量してはならない。	相加作用
注意	ドパミン作動薬((レボドパ製剤、メシル酸プロモクリプチン))	相互に作用↓	拮抗作用
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	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	アルコール(飲酒)	相互に中枢神経抑制作用↑	相加作用
注意	H2受容体遮断薬((シメチジン等))	胃液分泌↓ 観察を十分に行い、慎重に投与する。	相加作用
注意	CYP3A4の選択的阻害剤((マクロライド系抗生物質等))	本剤の作用↑ 観察を十分に行い、慎重に投与する。	代謝阻害により、血中濃度↑
注意	CYP3A4によって代謝される薬剤((シサプリド、トリアゾラム等))	本剤および併用薬の作用↑	CYP3A4による代謝が競合的に阻害され、本剤および併用薬の血中濃度↑

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
ペルフェナジン	ピーゼットシー、トリラホン	-	-	-
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、術前・術後の悪心・嘔吐、メニエル症候群（眩暈、耳鳴）	1日6～24mg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、通常成人1日6～48mgを分割経口投与する。年齢・症状により適宜増減。		高齢者では起立性低血圧、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。
薬物動態				
<p>（参考）外国人のデータ  ペルフェナジンは、遺伝的多型を有する薬物代謝酵素CYP2D6（チトクロームP450分子種の一つ）により代謝される。CYP2D6の遺伝的欠損者におけるペルフェナジンの血清中濃度は、正常者の約2倍高い濃度になるという報告事例もある。また、その報告事例において、2～24mg/manの経口投与で、欠損者と正常者の定常状態におけるペルフェナジン血清中濃度の範囲は0.5～12nmol/Lであった。</p>				
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（ポスミン）	重篤な血圧降下	本剤の $\alpha$ 受容体遮断作用により、 $\beta$ 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、排尿障害、頻脈、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、プロモクリプテンメシル酸塩）	相互に作用↓	拮抗作用
注意	パロキセチン	本剤の作用↑が増強され、過鎮静及び錐体外路症状が発現したとの報告がある。 減量するなど慎重に投与する。	本剤の代謝が阻害され、血中濃度が上昇する可能性がある。