

○セロクエル錠・クエチアピン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】クエチアピン フマル酸塩 (U) Quetiapine Fumarate 【分類】非定型抗精神病薬 [MARTA]

【単位】○25mg・▼100mg・▼200mg/錠

【常用量】1回25mg/日2~3回から開始し徐々に増量。維持量は150~600mg/日 [最大750mg]

【用法】分2~3

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (1, Thyrum PT, et al: Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry 24: 521-33, 2000)

【その他の報告】腎障害患者では Cmax, AUC が 1.5 倍高くなるが消失速度は遅延せず, Ccr と CL/F は相関しない (1)

【特徴】ジベンゾチアゼピン誘導体の 5-HT₂, D₂ 受容体拮抗性統合失調症治療薬 (MARTA)。5HT₂ 受容体に親和性が相対的に高い。錐体外路症状の誘発能は弱い。陽性症状に対する作用は弱い。鎮静や催眠に有利な理由としてヒスタミン受容体拮抗作用が相対的に強いことがある。パーキンソン症状がある場合とレビー小体型認知症での抗精神病薬の第 1 選択。

【主な副作用・毒性】高血糖, 糖尿病性ケトアシドーシス, 糖尿病性昏睡, 体重増加, 錐体外路症状, RLS, 悪性症候群, 痙攣, 起立性低血圧, 頻脈, 肝機能障害, 無顆粒球症, 傾眠, 不眠, 神経過敏, 倦怠感, 頭痛, めまい, T₄ 減少, プロラクチン上昇, 便秘, 食欲不振など。

【安全性に関する情報】α遮断作用があるので低血圧時にアドレナリン, ドパミンを使用すると血圧が低下する可能性があるため投与しない (1) 中毒時には活性体投与が有用かもしれない (Isbister GK, et al: Clin Pharmacol Ther 81: 821-7, 2007) 高血糖・糖尿病性ケトアシドーシス・糖尿病性昏睡に注意 (1) 副腎不全に関連した低血糖と低 Na 血症をきたした 1 例 (井出 敦基, 日腎会誌 59: 870, 2017) QT 延長ハイリスク例への投与は慎重に (1) 急激な減量や中止による離脱症状が現れることがあるため漸減 (1) AKI の症例 (Yamada H, et al: Intern Med 2018 PMID: 29434130)

HD 患者の免疫介在性血栓性微小血管障害の症例 (Takahashi M, et al: CEN Case Rep 2021 PMID: 32981026)

HD 患者において他の QT 延長に関する警告のない非定型抗精神病薬と比較して突然死のリスクになっていなかった (Nash RP, et al: Gen Hosp Psychiatry 2023 PMID: 39108558)

【モニターすべき項目】甲状腺機能, 肝機能, 自殺企図, 視力

【吸収】食事の影響を受けない (1) 吸収率 72.8%以上 (1) 速やかに吸収される (U)

【F】5.7% [サル] (1)

【tmax】1.25~2.9hr (1) 2hr (U)

【代謝】CYP3A4 で代謝され M-4 となる (寄与率 15%程度)。代謝物 M-1 と M-2 は活性を有するが, その血中濃度は低く活性も低い (1) CYP3A4 で代謝され, スルホン化経路がメイン (U) 代謝物のノルクエチアピンは活性あり (Cutler A, et al: CNS Specor 13(S9):3-14, 2008)

【排泄】尿中未変化体排泄率 1%未満 (1) 尿中の主代謝物は M-8 と M-10 (1) 95%は代謝され, 73%が尿中に 20%が糞便中に排泄される (U) 尿中回収率 73% (DeVane CL, Nemeroff CB: Clin Pharmacokinetics 40: 509-22, 2001)

【CL/F】51~67L/hr (1) 肝障害時には 25%低下 (1)

【t_{1/2}】3.3~3.5hr (1) 6~7hr (U) 7hr (DeVane CL, Nemeroff CB: Clin Pharmacokinetics 40: 509-22, 2001)

【蛋白結合率】83% (1,U)

【Vd/F】672~710L/man (1) 10±4L/kg (U) 腎障害患者 310L/man (1)

【MW】883.09

【透析性】除去されにくいと思われる (5) 資料なし (1)

【O/W 係数】389.7 [1-オクタノール/水系, pH7] (1)

【相互作用】アドレナリンの作用を逆転させ, 重篤な血圧降下を起こすことがあるため併用禁忌 (1) CYP3A4 を誘導するフェニトインやカルバマゼピンとの併用で AUC が 80%以上低下 (1) チオリダジンの併用で AUC が 40~50%低下 (1) エリスロマイシン, イトラコナゾール: CYP3A4 の阻害作用を有しているため注意 (1) C/D 比 [CL の逆数] がフルボキサミン併用で 159%上昇, クロザピン併用で 82%上昇, 70 歳以上の高齢者で 67%上昇, カルバマゼピン併用で 86%低下 (Castberg I, et al: J Clin Psychiatry 68: 1540-5, 2007)

【肝障害患者における情報】少量から開始し, 増量幅を 25~50mg とするなど慎重に投与 (1)

【備考】認知症による不穏行動の抑制には適用されない

【更新日】20241003

※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などでご確認ください。

※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。