

△アナフラニール錠 [内]・▼点滴静注液 [注]

【重要度】 【一般製剤名】クロミプラミン塩酸塩 (U) Clomipramine Hydrochloride 【分類】三環系抗うつ薬

【単位】▼10mg・△25mg/錠, ▼点滴静注液 25mg/A [2mL]

【常用量】

■うつ病・うつ状態

50～100mg/日 [最大 225mg/日]

■遺尿症

6歳未満の幼児 10～25mg/日, 6歳以上の小児 20～50mg/日

■ナルコレプシーに伴う情動脱力発作

10～75mg/日

■点滴静注：25～75mg/日

【用法】■経口：分2～3

■点滴静注：2～3hr かけて点滴静注 [生食または5%G注射液で希釈]

【透析患者への投与方法】少量から開始し、効果をモニターしつつ増量 (3)

【その他の報告】減量の必要なく、HD 後補充も不要 (12,17)

【PD】減量の必要なし (12,17)

【CRRT】データがなく提示できないが、使用するなら少量から開始して注意してモニター (17) 減量の必要なし (12)

【保存期CKD患者への投与方法】GFR 50mL/min 未満：少量から開始し、効果をモニターしつつ増量 (3)

【その他の報告】減量の必要なし (12,17)

【特徴】ノルアドレナリンに比べ、セロトニン再取り込み阻害作用が強い。抗コリン作用が強く、鎮静作用は中等度。

【主な副作用・毒性】抗コリン性の副作用、悪性症候群、セロトニン症候群、麻痺性イレウス、肝機能障害、血圧降下、ふらつき・めまい、消化器症状など

【F】良好に吸収されるが、初回通過効果を受ける (Balant-Gorgia AE, et al: Clin Pharmacokinet 20: 447-62, 1991)

【tmax】1.5～4hr (1)

【代謝】主にCYP2D6により代謝され、CYP1A2, 3A4, 2C19も関与 (1) 非線形体内動態を示し、投与量を2倍にすると未変化体の血中濃度は3倍に、脱メチル化体の血中濃度は4倍に上昇する (Kuss HJ, et al: Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry 10:739-48, 1986) 水酸化体や脱メチル化体への代謝比の個人差は30～90倍 (Shimoda K, et al: J Clin Psychopharmacol 13: 181-8, 1993) 15-35倍 (Noguchi T, et al: Affect Disord 29: 267-79, 1993) 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 (1) 活性代謝物デスメチル体 (U)

【排泄】尿中未変化体排泄率1%以下 (1) 尿中に抱合体として2/3が排泄される (1)

【CL】CL/F : 73L/hr (Dawling S, et al: Postgrad Med J 56 Suppl 1:115-6, 1980) 0.441L/hr/kg [im] (de Cuyper HJ, et al: Psychiatry Res 4: 147-56, 1981) 0.65±0.15L/kg/hr [iv] (1)

【t1/2】21hr (1) 36hr (Dawling S, et al: Postgrad Med J 56 Suppl 1: 115-6, 1980) 未変化体 24hr, 脱メチル化体 96hr (Balant-Gorgia AE, et al: Clin Pharmacokinet 20: 447-62, 1991) 21～31hr (U)

【蛋白結合率】高い (Balant-Gorgia AE, et al: Clin Pharmacokinet 20: 447-62, 1991) 96～97% (U) 96% (1) 97% (12)

【Vd】1000L/man 以上 (Balant-Gorgia AE, et al: Clin Pharmacokinet 20: 447-62, 1991) 12L/kg (U) 16.6±4.9L/kg [iv] (1)

【MW】351.31

【透析性】除去されない (5)

【OW係数】資料なし (1)

【TDMのポイント】抗うつ効果は150ng/mL未満は無効であることが多いが、450ng/mL以上にしても効果の増強は認められない (Balant-Gorgia AE, et al: Clin Pharmacokinet 20: 447-62, 1991) 鎮痛作用としての有効域は20～85ng/mL (Montastruc JL, et al: Clin Neuropharmacol 8: 78-82, 1985) 血中濃度と抗うつ効果の関連は弱いながら認められる (Danish University Antidepressant Group: Clin Pharmacol Ther 66: 152-65, 1999)

【相互作用】MAO阻害剤と併用禁忌 [中止後2週間以内を含む] (1) SSRI : セロトニン症候群 (1)

【更新日】20211227

※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。