

▼スルモンチール錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 トリミプラミンマレイン酸塩 trimipramine maleate 【分類】 抗うつ剤 [三環系]

【単位】 ▼10mg・▼25mg/錠

【常用量】 初期量50～100mg/日, 200mg/日まで漸増 [最大 300mg]

【用法】 分割投与

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (12)

【その他の報告】 設定されていないが, おそらく減量の必要はない [PK変動には腎不全以外の要因が大きいと思われる] (5)

【PD】 減量の必要なし (12)

【CRRT】 減量の必要なし (12)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (12)

【その他の報告】 Ccr 10mL/min 未満の患者では健康人に比べて AUC が有意に高くなるが t1/2 は変わらない (Degen J, et al: Med Klin (Munich) 88: 129-33, 1993 [abstract])

設定されていないが, おそらく減量の必要はない [PK変動には腎不全以外の要因が大きいと思われる] (5)

【特徴】 三環系抗うつ薬で, 鎮静作用が強く, 不安, 焦燥, 睡眠障害などの改善が期待できる。

【主な副作用・毒性】 悪性症候群, 無顆粒球症, 麻痺性イレウス, 錯乱, 幻覚, SIADH, 発疹, 肝機能障害, パーキンソン症状, 血圧降下, 口渇, 頻脈, 排尿困難, 視調節障害, 便秘, 味覚異常, 悪心・嘔吐など。

【安全性に関する情報】 特異的な解毒剤はない。自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させない。投与量の急激な減少ないし投与の中止により, 嘔気, 頭痛, 倦怠感, 易刺激性, 情動不安, 睡眠障害等の離脱症状があらわれることがあり, 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 (1)

【F】 41.4±4.4% [範囲 17.8～62.7%] (1, Abernethy DR, et al: Clin Pharmacol Ther 35: 348-53, 1984) CYP2D6 の EM より PM で 3 倍高い (Kirchheiner J, et al: J Clin Psychopharmacol 23: 459-66, 2003)

【tmax】 3hr (1)

【代謝】 肝で複数の代謝物に変換され, 腸肝循環し, 一部は抱合体として尿中に排泄される (1) 主な活性代謝物は desmethyltrimipramine (1) 脱メチル化には CYP2D6 が関与し, PM では RM に比べて脱メチル体の AUC が 40 倍高く, 脱メチル体は CYP2C9, 2C19 でさらに代謝 (Kirchheiner J, et al: J Clin Psychopharmacol 23: 459-66, 2003)

【排泄】 抱合体として尿中に排泄 [animal] (1)

【CL/F】 15.9±1.5mL/min/kg (1, Abernethy DR, et al: Clin Pharmacol Ther 35: 348-53, 1984) CYP2D6 の EM で 276L/hr, PM で 36L/hr (Kirchheiner J, et al: J Clin Psychopharmacol 23: 459-66, 2003)

【t1/2】 24hr (1,12) 23±1.9hr [iv] (Abernethy DR, et al: Clin Pharmacol Ther 35: 348-53, 1984)

【蛋白結合率】 94.9±0.3% (1) 90～96% (12)

【Vd】 30.9±3.5L/kg (1, Abernethy DR, et al: Clin Pharmacol Ther 35: 348-53, 1984) P-gp が細胞内移行を制限している [ラット] (Uhr M, et al: J Psychiatr Res 37: 179-85, 2003) 31L/kg (12)

【MW】 410.51

【透析性】 除去は低い (1)

【TDM のポイント】 一般に血漿中濃度と症状との相関はみられないが, 1000 ng/mL 以上で危険な ECG, 心抑制がみられる (1) CYP2D6 の PM では血中濃度上昇, ultra-rapid metabolizer では血中濃度が低くなる原因となる (Kirchheiner J, et al: Pharmacogenetics 13: 721-8, 2003)

【O/W 係数】 21.4 [1-オクタノール/buffer, pH 5] (1)

【相互作用】 MAO 阻害剤と併用禁忌 (1) フルボキサミン併用で本剤の血中濃度が 2 倍に上昇 (Seifritz E, et al: Eur Neuropsychopharmacol 4: 15-20, 1994)

【更新日】 20170417

※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。