

◎テシプール錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】セチプチリンマレイン酸塩 setiptiline maleate 【分類】四環系抗うつ剤

【単位】◎1mg/錠

【常用量】初期量3mg/日 [最大6mg/日]

【用法】分割投与

【透析患者への投与方法】透析患者の投与方法に言及した文献はないが、脂溶性薬物であるためおそらく減量の必要性はないであろう (5)

【その他の報告】腎障害のある患者では排泄能の低下により作用が増強することがあるため慎重投与 (1)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要はないと思われる (5)

【その他の報告】腎障害のある患者では排泄能の低下により作用が増強することがあるため慎重投与 (1)

【特徴】四環系抗うつ薬で、シナプス前の α 2-アドレナリン受容体を遮断し、シナプス間隙へのノルアドレナリン遊離を促進するとともに、脳内ノルアドレナリンの代謝回転を亢進させることにより中枢ノルアドレナリン作動性神経の活動度を増強することと考えられている。有効と判定される95%は2週間以内に効果を発現している (中村 碩之: ファルマシア 26: 150, 1990) 抗コリン作用があるので緑内障、排尿困難、眼内圧亢進等のある患者には慎重投与。

【主な副作用・毒性】悪性症候群、無顆粒白血球症、眠気、めまい・ふらつき・立ちくらみ、倦怠感・脱力感、頭痛、血圧低下、心悸亢進・頻脈、口渇、排尿困難、消化器症状など。

【安全性に関する情報】自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させない (1) 過量服用により、血圧低下、不整脈、精神障害、痙攣、呼吸抑制等が発現するおそれがある (1) 投与量の急激な減少ないし投与の中止により、嘔気、頭痛、けん怠感、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るため、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) 80歳以上の患者において血中濃度が高い傾向が報告されており、一般に高齢者では起立性低血圧、ふらつき等があらわれやすいので少量から投与を開始 (1)

【吸収】 $ka=1.251 \pm 1.009/hr$ (1)

【F】資料なし (1)

【 t_{max}] 1~3hr (1)

【代謝】主代謝物は水酸化体、N-オキシド体、脱メチル化体 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率0.36% [po, 48hr まで] (1) 尿中排泄率21%で11%は未変化体の抱合体 (1)

【CL】年齢と相関 (Kamimura M, et al: Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry 18: 1015-26, 1994) 資料なし (1) $CL/F=71L/hr$ [経口AUCより] (1)

【 $t_{1/2}$] α 相2hr, β 相24hr (1) $ke=0.105 \pm 0.024/hr$ (1)

【蛋白結合率】47.2~51.5% [ラット] (1) 86~88% [vitro] (1)

【Vd/F】 $0.810 \pm 0.321L/kg$ [po] (1)

【MW】377.44

【透析性】資料なし (1) 中毒時の透析の有用性は確立していない (1)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない【薬物動態】血中濃度に個人差はあるが線形 (Kamimura M, et al: Prog Neuropsychopharmacol Biol Psychiatry 18: 1015-26, 1994) 【pKa】7.81 (1)

【相互作用】MAO阻害薬と併用禁忌 (1) 中枢神経抑制剤と併用注意 (1)

【備考】帯状疱疹後神経痛に有効である可能性 (占部篤道: 西日本皮膚科 55: 998-1000, 1993)

【更新日】20170123

※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。