

○テトラミド錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ミアンセリン塩酸塩 Mianserin Hydrochloride 【分類】四環系抗うつ剤

【単位】○10mg・▼30mg/錠

【常用量】30mg/日から開始し、60mg/日まで増量

【用法】分1〜2で、1日1回夕食後または寝る前も可

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】主として $\alpha 2$ 受容体阻害によるノルエピネフリン放出を促進する。ノルエピネフリンの再取り込み抑制作用は弱い。

【主な副作用・毒性】悪性症候群、血球減少、動悸、血圧低下、振せん、不眠、視調節障害、消化器症状など。QT延長に注意。

【吸収】70%以上吸収されるが初回通過効果を受ける (11) ほゞ完全に吸収される (Debressine LP, et al: Xenobiotica 22: 227-36, 1992)

【F】初回通過効果のため20〜30% (11) 20% (1)

【tmax】高齢者2.2hr (Maguire K, et al: Psychiatry Res 8: 281-7, 1983) 3hr (11)

【代謝】CYP1A2, 2D6, 3A4により代謝され、活性体のS(+)¹のhydroxylationには2D6, demethylationおよびN-oxidationには1A2が関与 (1) p-酸化、N-芳香環置換、抱合体、酸化体、脱メチル体の5種類に代謝される (Debressine LP, et al: Xenobiotica 22: 227-36, 1992) 水酸化、脱メチル化、酸化により代謝され、大部分抱合体として尿中排泄される (11) 脱メチル化体が主代謝物 (11) CYP2D6により代謝 (Bertilsson L: Clin Pharmacol Ther 82: 606-9, 2007) 尿中主要代謝物3種 (8-OH体、脱メチル体、N-オキシド体) の活性は未変化体と同程度であるが存在比は低い (1)

【排泄】尿中回収率53%で、そのうち15%がミアンセリンおよびその抱合体 (de Jongh GD, et al: Drug Metab Dispos 9: 48-53, 1981)

尿中未変化体排泄率5% (11)

【CL】 $0.52 \pm 0.05 \text{L/kg/hr}$ (1) 高齢者 490mL/hr/kg (Maguire K, et al: Psychiatry Res 8: 281-7, 1983)

【t1/2】若年者: 9.6hr、高齢者: 27hr (Shami M, et al: Br J Clin Pharmacol 15: Suppl2: 313S-22S, 1983) 高齢者 α 相: 3.4hr、 β 相: 33hr (Maguire K, et al: Psychiatry Res 8: 281-7, 1983) 10〜20hr、平均16hr、高齢者では40hrに延長 (11)

【蛋白結合率】96.4% (11) 90% (1)

【Vd】 $Vd/F=15.7 \pm 2.2 \text{L/kg}$ (1) 高齢者 20.2L/kg (Maguire K, et al: Psychiatry Res 8: 281-7, 1983) 13L/kg (11)

【MW】300.8(264.4)

【透析性】Vdが非常に大きいため透析によってほとんど除去されないと考えられる (5) 除去されない (Schlotterbeck PM, et al: Pharmacopsychiatry 2008 PMID: 19067265)

【O/W係数】1000以上 (11) $\text{LogP}=2.8$ [1-オクタノール水系 (第2液)] (1) 【pKa】7.05

【相互作用】MAO阻害剤と併用禁忌 (1) CYP3A4誘導剤により作用減弱の可能性 (1) リネゾリドと併用注意 [アドレナリン系の増強、MAO阻害による影響] (1)

【備考】

【更新日】20240714

※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。