

▼アモキシサンカプセル [内]

【重要度】 【一般製剤名】アモキシサピン (U) amoxapine 【分類】三環系抗うつ薬

【単位】▼10mg・▼25mg・▼50mg/Cap

【常用量】25～75mg/日, 効果不十分な場合 150mg/日 [最大 300mg/日]

【用法】分1～分割投与

【透析患者への投与方法】不明 (3)

悪性症候群に関連した症例 (Kunishima Y, et al: Int J Urol 2000 PMID: 10710250)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (3,12)

【特徴】ジベンズオキサゼピン誘導体の三環系抗うつ薬で, 抗コリン作用は中等度, 鎮静作用は低く, 起立性低血圧の頻度も低い。

【主な副作用・毒性】悪性症候群, 痙攣, 錯乱, 無顆粒球症, 麻痺性イレウス, 遅発性ジスキネジア, SJS, TEN, SIADH, 血圧降下, 心ブロック, 眠気, 不眠, 振せん, アカシジア, 口渇, 排尿困難, 視力障害, 消化器症状など。

【安全性に関する情報】意図的過量投与で横紋筋融解症, 腎不全の報告 (複数) あり (Abero K, et al: J Clin Psychiatry. 1982 PMID: 7118837)

【吸収】ほぼ完全に吸収される (Kinney JL, Evans RL Jr: Clin Pharm 1: 417-24, 1982) 小腸から吸収 (1)

【tmax】1～2hr (Kinney JL, Evans RL Jr: Clin Pharm 1: 417-24, 1982) 1～1.5hr (1)

【代謝】8-水酸化体で代謝される (1) 肝臓で芳香環の水酸化により 2つの代謝物 [8-水酸化体と7-水酸化体] に代謝される (Kinney JL, Evans RL Jr: Clin Pharm 1: 417-24, 1982) 8-水酸化体は7-水酸化体より高濃度であり, 消失も遅い (Calvo B, et al: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 23: 180-5, 1985) 未変化体と比べ, 8-水酸化体のノルエピネフリン再取り込み阻害作用は同等で, セロトニン再取り込み阻害作用は強い (Midha KK, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 37: 428-38, 1999) 7-水酸化体はシナプス後ドパミン阻害作用を有する (Midha KK, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 37: 428-38, 1999) 7-水酸化体および8-水酸化体には活性がある (U) 7-水酸化体には D2 antagonist 作用があり, TCA と定型抗精神病薬の併用と同様の薬理作用が想定される (日本うつ病学会治療ガイドライン: II うつ病 (DSM 5) / 大うつ病性 障害 2016)

【排泄】尿中回収率 60% [120hr まで] で主として 8-水酸化体のグルクロン酸抱合体 (1) 代謝物は尿中および糞便中に排泄される (Kinney JL, Evans RL Jr: Clin Pharm 1: 417-24, 1982)

【CL】資料なし (1)

【t1/2】未変化体 8hr, 代謝物 8-OH 体 30hr (Kinney JL, Evans RL Jr: Clin Pharm 1: 417-24, 1982) 2相性に消失し未変化体 9.8 ± 2.6 hr, 8-水酸化体 30.8hr, 7-水酸化体 5.1hr (Calvo B, et al: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 23: 180-5, 1985) 8～30hr (U) 活性代謝物の半減期 30hr (12)

【蛋白結合率】15～60% [ラット] (1) 92% (U)

【Vd/F】単回投与成績よりおよそ 1000L/man (1) 資料なし (1,U)

【MW】313.78

【透析性】資料なし (1) 除去されにくい (U)

【OW 係数】資料なし (1)

【相互作用】フェンタニルとの併用でセロトニン症候群が発現 (松岡鐘文, 他: 第 31 回日本臨床麻酔学会抄録 S370, 2011) MAO-I との併用禁忌 [中止後 2 週間あける] (1) リネゾリドやメチレンブルーとの併用でセロトニン症候群のおそれ (1)

【備考】大量投与時には痙攣が出現することがある。骨折リスクの上昇が指摘されている (1)

【更新日】20200527

※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。