

サリチルアミド、アセトアミノフェン、無水カフェイン配合

PL (塩野義), 顆粒 1g 中: サリチルアミド 270mg, アセトアミノフェン 150mg, 無水カフェイン 60mg, メチレンジサリチル酸プロメタジン 13.5mg, 幼児用 PL 顆粒, 1g 中: サリチルアミド 45mg, アセトアミノフェン 25mg, 無水カフェイン 10mg, メチレンジサリチル酸プロメタジン 2.25mg

【適応 (効能・効果)】 感冒若しくは上気道炎に伴う下記症状の改善及び緩和: 鼻汁, 鼻閉, 咽・喉頭痛, 頭痛, 関節痛, 筋肉痛, 発熱

【用法・用量】 [成人] 1 回 1g, 1 日 4 回, [幼児用] 2~4 歳 1 回 1g (1 包) 1 日 4 回, 5~8 歳 1 回 2g (2 包) 1 日 4 回, 9~11 歳 1 回 3g (3 包) 1 日 4 回

【臨床成績】 各症状の改善率: プラセボと有意差あり

【薬効薬理】 ①体温下降作用 ②鎮痛作用 ③解熱鎮痛作用 (サリチルアミド・アセトアミノフェン) ④鎮痛作用の増強 (メチレンジサリチル酸プロメタジン) ⑤中枢神経興奮作用 (カフェイン)

【薬物動態】 24 時間以内に単回 90~100% 尿中排泄

【薬物代謝】 サリチルアミド: ほとんど完全に不活性代謝物に代謝, 24 時間以内に 90~100% 尿中排泄 カフェイン: CYP1A2 による脱メチル化及び酸化, 尿中排泄 アセトアミノフェン, プロメタジン→各項参照

【禁忌】 ①本剤成分, サリチル酸製

剤 (アスピリン等), フェノチアジン系化合物又はその類似化合物に過敏症 ②消化性潰瘍 ③アスピリン喘息 ④昏睡状態の患者又はバルビツール酸誘導体・麻酔剤等の中枢神経抑制剤の強い影響下にある患者 ⑤緑内障 ⑥前立腺肥大等, 下部尿路閉塞性疾患 ⑦2 歳未満の乳幼児

【慎重投与】 ①肝障害, 腎障害 ②出血傾向 ③気管支喘息

【相互作用・併用注意】 [詳細は各配合薬の項参照] ①ワルファリン ②糖尿病用剤 ③中枢神経抑制剤 ④アルコール ⑤降圧剤 ⑥抗コリン作用を有する薬剤 (フェノチアジン系化合物, 三環系抗うつ剤等)

【重大な副作用】 ショック, アナフィラキシー様症状 (0.1%未満), 剥脱性皮膚炎, Stevens-Johnson 症候群, Lyell 症候群 (0.1%未満), 再生不良性貧血 (0.1%未満), 無顆粒球症, 溶血性貧血, 血小板減少 (頻度不明), 喘息発作の誘発 (頻度不明), 間質性肺炎 (0.1%未満), 好酸球性肺炎 (頻度不明), 肝機能障害, 黄疸 (頻度不明), 乳児突然死症候群 (SIDS), 乳児睡眠時無呼吸発作 (頻度不明), 間質性腎炎, 急性腎不全 (頻度不明), 横紋筋融解症 (頻度不明), 緑内障 (頻度不明)

【副作用】 (成人用) [5%以上または頻度不明] 食欲不振, 胸やけ, 胃痛, 悪心・嘔吐, 口渇, 消化管出血, 眠気, めまい, 倦怠感, 頭痛, 耳鳴, 難聴, 視覚障害, 不安感, 興奮, 神経過敏, 不眠, 痙攣, せん妄, チアノーゼ, 過呼吸, 代謝性アシドーシス

【妊婦・授乳婦】 妊婦: サリチル酸 (アスピリン) を参照, 授乳婦: 長

期連用を避ける

【小児・高齢者】 小児: 1)2 歳未満: 禁忌 (幼児用 PL も禁忌) [致死的な呼吸抑制] 2)2 歳以上の幼児, 小児: 有益性>危険性のみ投与 {安全性未確立}, 高齢者: 減量など注意 **【特記事項】** 各配合剤の項参照 ライ症候群 [サリチル酸の項参照] → 15 歳未満の水痘, インフルエンザの患者には原則投与不可: やむを得ず投与する場合は, 慎重に投与し, 十分観察

ペレックス (大鵬), 顆粒 1g 中: サリチルアミド 270mg, アセトアミノフェン 150mg, 無水カフェイン 30mg, マレイン酸クロルフェニラミン 3mg, ペレックス 1/6 顆粒 1g 中: サリチルアミド 45mg, アセトアミノフェン 25mg, 無水カフェイン 5mg, マレイン酸クロルフェニラミン 0.5mg

【適応 (効能・効果)】 感冒もしくは上気道炎に伴う下記症状の改善及び緩和, 鼻汁, 鼻閉, 咽・喉頭痛, 咳, 痰, 頭痛, 関節痛, 筋肉痛, 発熱

【用法・用量】 [ペレックス顆粒] 1 回 1g, 1 日 3~4 回, [1/6 顆粒] 1 回 2~4 歳は 1g, 5~8 歳は 2g, 9~12 歳は 3g を 1 日 3~4 回

【臨床成績】 ペレックス顆粒: 有効率 80.2%, ペレックス 1/6: 有効率 76.8%

【薬効薬理】 【薬物代謝】 各配合成分及び PL 顆粒参照

【禁忌】 → PL 顆粒の①②③⑤⑥参照

【慎重投与】 PL 顆粒参照

【相互作用・併用注意】 PL 顆粒①②③④ (③はペレックス顆粒のみ)

及び MAO 阻害剤 [マレイン酸クロルフェニラミンの抗コリン作用増強→相互に作用増強]

【重大な副作用】 → PL 顆粒①~⑥⑨参照

【副作用】 食欲不振 3.1%, 胃部不快感 2.8%, 眠気 1.3%等

【妊婦・授乳婦】 → PL 顆粒参照

【小児・高齢者】 高齢者: 減量など注意

【特記事項】 → PL 顆粒参照 本剤は小児に禁忌はない (15 歳未満の水痘, インフルエンザ患者には原則投与不可)

過活動膀胱治療剤

**コハク酸ソリフェナシン
solifenacin succinate**

ベシケア (アステラス) : 錠 2.5mg, 5mg

【適応 (効能・効果)】 過活動膀胱における尿意切迫感, 頻尿及び切迫性尿失禁

【用法・用量】 5mg を 1 日 1 回投与, 1 日最大 10mg まで

【薬効薬理】 ムスカリン受容体拮抗作用, 用量依存的膀胱容量及び排尿量増加作用, 膀胱過緊張状態抑制作用, 過活動膀胱における尿意切迫感, 頻尿及び切迫性尿失禁改善作用

【薬物動態】 (5 mg 投与) Tmax : 5.5 時間, $T_{1/2}$: 3.8 時間, 食事の影響なし, (高齢者) Cmax 及び AUC 増加, $T_{1/2}$ 延長 (腎機能障害, 肝機能障害) AUC 高値

【薬物代謝】 蛋白結合率 : 96% 主として CYP3A4 代謝, 一部 CYP1A1, 2C8, 2C19, 2D6 及び 3A5 並びにグルクロン酸抱合酵素も代謝に関与, 尿中 69.2%

【禁忌】 ①本剤過敏症 ②尿閉 ③閉塞隅角緑内障 ④幽門部, 十二指腸又は腸管閉塞及び麻痺性イレウス ⑤胃アトニー又は腸アトニー ⑥重症筋無力症 ⑦重篤な心疾患 ⑧重度の肝機能障害

【慎重投与】 ①下部尿路閉塞疾患 (前立腺肥大症等) ②潰瘍性大腸炎 ③甲状腺機能亢進症 ④肝機能障害 ⑤認知症又は認知機能障害 ⑥パーキンソン症状又は脳血管障害 ⑦高齢者

【併用注意】 ①抗コリン剤, 三環系抗うつ剤, フェノチアジン系薬剤,

モノアミン酸化酵素阻害剤→口内乾燥, 便秘, 排尿困難等 : 抗コリン作用増強 ②アゾール系抗真菌剤 (イトラコナゾール, フルコナゾール, ミコナゾール) →口内乾燥, 便秘, 排尿困難等 : CYP3A4 阻害により本剤血中濃度上昇 ③リファンピシン, フェニトイン, カルバマゼピン : 本剤の作用減弱→CYP3A4 誘導により本剤の血中濃度低下

【重大な副作用】 ① AST, ALT, γ -GTP, Al-P, 総ビリルビン↑ (各 0.1 ~ 5% 未満) 等→中止 ②尿閉 (頻度不明) →中止 ③ (類薬) 急性緑内障発作, 麻痺性イレウス, 幻覚・せん妄, QT 延長, 心室性頻拍, 房室ブロック, 徐脈等→中止

【副作用】 口内乾燥 (28.3%), 便秘 (14.4%), 霧視 (3.3%), BUN 上昇 (2.1%), 尿沈渣陽性 (1.9%) など

【特記事項】 ①中等度の肝機能障害, または重度の腎機能障害 (クレアチニンクリアランス 30ml/min 未満) : 1 日 1 回 2.5mg から開始 ②高所作業, 自動車の運転等危険を伴う作業は注意 : 眼調節障害 (霧視等)

過活動膀胱治療剤

酒石酸トルテロジン
tolterodine tartrate

デトルシトール（ファイザー）：カプセル 2mg, 4mg

【適応（効能・効果）】 過活動膀胱における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁

【用法・用量】 4mgを1日1回（腎障害、肝障害、又はマクロライド系抗生物質及びアゾール系抗真菌薬等のチトクロム P450 分子種（CYP3A4）阻害薬を併用時）：2mgを1日1回

【薬効薬理】 膀胱収縮抑制作用、ムスカリン受容体拮抗作用

【薬物動態】（トルテロジン 4mg）
tmax：4時間，T_{1/2}：11.3時間，食事の影響：なし，腎機能障害：血清中濃度高値，肝機能障害：T_{1/2}延長

【薬物代謝】 CYP2D6 及び CYP3A4 代謝，尿中排泄 77%

【禁忌】 ①尿閉（慢性尿閉に伴う溢流性尿失禁を含む） ②眼圧が調節できない閉塞隅角緑内障 ③重篤な心疾患 ④麻痺性イレウス ⑤胃アトニー又は腸アトニー ⑥重症筋無力症 ⑦本剤の成分過敏症

【慎重投与】 ①尿閉 ②排尿困難のある前立腺肥大 ③胃腸管運動低下 ④潰瘍性大腸炎 ⑤眼圧が調節可能な閉塞隅角緑内障 ⑥狭心症等の虚血性心疾患 ⑦クラス IA（キニジン，プロカインアミド等）又はクラス III（アミオダロン，ソタロール等）の抗不整脈薬を投与中の患者を含む QT 延長症候群 ⑧甲状腺機能亢進症 ⑨腎障害 ⑩肝障害 ⑪認知症，認知機能障害

⑫パーキンソン症状又は脳血管障害

【併用注意】 ①抗コリン作用を有する薬剤（抗パーキンソン剤，消化性潰瘍治療剤等）→口内乾燥，便秘，排尿困難，視力異常等：本剤のムスカリン受容体拮抗作用 ② CYP3A4 阻害薬（マクロライド系抗生物質，アゾール系抗真菌薬，シクロスポリン，ピンブラスチン等）→効果や副作用の増強（1日用量を2mgに減量）：併用薬剤の CYP3A4 阻害作用

【重大な副作用】 アナフィラキシー様症状（頻度不明）→中止，尿閉（0.3%）→中止

【高頻度の副作用】 口内乾燥（32.8%），便秘（7.6%），腹痛，消化不良（3.0%），健忘（頻度不明）→中止，幻覚（頻度不明）→ネオスチグミン投与，頻脈（1%未満）→β-アドレナリン遮断薬投与

【特記事項】 自動車の運転等危険を伴う機械の操作に注意：眼調節障害，めまい，眠気

炭酸リチウム lithium carbonate

リーマス (大正富山/大正製薬)

錠：100mg, 200mg

【適応 (効能・効果)】 躁病及び躁うつ病の躁状態

【用法・用量】 1日 400～600mg より開始し、1日 2～3回に分割経口投与。以後 3日ないし 1週間毎に、1日通常 1200mg までの治療量に漸増する。改善がみられたならば症状を観察しながら、維持量 1日通常 200～800mg、1～3回分割経口投与に漸減する

【臨床成績】 有効率：躁病 76.5%：躁うつ病の躁状態 71.9%

【薬効薬理】 ①自発運動抑制作用 ②抗メタンフェタミン作用 ③条件回避反応抑制作用 ④闘争行動抑制作用 ⑤脳神経細胞への遊離カテコールアミンの再取り込みを阻害作用

【薬物動態】 健康成人、200mg、経口、T_{max}：2.6時間、C_{max}：0.22 mEq/L、T_{1/2}：18時間、排泄：尿中排泄 94.6% (400mg 経口、128時間まで)

【薬物代謝】 尿中排泄

【禁忌 (配合禁忌も含む)】 ①てんかん等の脳波異常 ②重篤な心疾患 ③リチウムの体内貯留を起しやす状態にある患者 (腎障害、衰弱又は脱水状態、発熱、発汗又は下痢を伴う疾患のある患者、食塩制限患者、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人)

【慎重投与】 ①脳に器質的障害のある患者 ②心疾患の既往歴 ③リチウムの体内貯留を起すおそれ

のある患者 (腎障害の既往歴のある患者、食事及び水分摂取量不足の患者、高齢者) ④肝障害 ⑤甲状腺機能亢進又は低下症 ⑥リチウムに異常な感受性を示す患者

【併用注意】 ①利尿剤 [チアジド系利尿剤、ループ利尿剤等] ②カルバマゼピン ③向精神薬 [ハロペリドール等] ④アンジオテンシン変換酵素阻害剤 [エナラプリル等] ⑤非ステロイド性消炎鎮痛剤 [ロキソプロフェナトリウム等] ⑥SSRI [マレイン酸フルボキサミン等] ⑦麻酔用筋弛緩剤 [塩化スキサメトニウム等]

【重大な副作用】 ①リチウム中毒 (初期症状として食欲低下、嘔気、嘔吐、下痢、振戦、傾眠、錯乱、運動障害、運動失調、発熱、発汗等の全身症状を示す。中毒が進行すると、急性腎不全により、全身けいれん、ミオクローヌスがみられることがある。リチウム中毒が発現した場合、特異的な解毒剤はないので、投与を中止し、感染症の予防、心・呼吸機能の維持とともに補液、利尿剤 (マンニトール、アミノフィリン等) 等により本剤の排泄促進、電解質平衡の回復を図ること。利尿剤に反応しない場合や腎障害が認められる場合は、血液透析を施行すること。血液透析を施行する場合は、施行後に低下した血清リチウム濃度が再上昇することがあるので、施行後血清リチウム濃度測定を行い再上昇がみられた場合には、再度の血液透析等の適切な処置を行うこと) ②徐脈 ③腎性尿崩症 ④痴呆様症状、意識障害

【副作用】 発現率：めまい、ねむけ、

口渇、嘔気・嘔吐、下痢、食欲不振、胃部不快感、白血球増多、多尿、振戦、肝機能異常、脱力・けん怠感 (0.5～5%未満)

【妊婦・授乳婦】 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること

【小児・高齢者】 小児等に対する安全性は確立していないので、小児等には治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合のみ投与すること、高齢者：慎重投与

【特記事項】 用法及び用量に関連する使用上の注意、過量投与による中毒を起すことがあるので、投与初期又は用量を増量したときには 1週 1ないし 2回、維持量の投与中には 1月 1回程度、早朝服薬前の血清リチウム濃度を測定しながら使用する、①血清リチウム濃度が 1.5mEq/L を超えたときは臨床症状の観察を十分に行い、必要に応じて減量又は休薬等の処置を行う ②血清リチウム濃度が 2.0mEq/L を超えたときは過量投与による中毒を起すことがあるので、減量又は休薬する

塩酸メチルフェニデート
methylphenidate hydrochloride

リタリン (ノバルティス), 錠
10mg, 散 1%

【適応 (効能・効果)】 ナルコレプシー, 抗うつ薬で効果の不十分な難治性うつ病, 遷延性うつ病に対する抗うつ薬との併用

【用法・用量】 ①ナルコレプシー: 1日 20~60mg, 1~2回に分経口投与 ②難治性うつ病, 遷延性うつ病: 1日 20~30mg, 2~3回に分経口投与

【臨床成績】 ナルコレプシーに対する有効率は 89.6%

【薬効薬理】 ①中枢興奮作用 ②自発運動に及ぼす影響 ③睡眠に及ぼす影響

【薬物動態】 $T_{1/2}$: 約 7 時間, 排泄: 尿中排泄 50% (8 時間まで), 同 90% (48 時間まで)

【薬物代謝】 尿中の主要代謝産物は脱エステル化体で主に尿中排泄

【禁忌 (配合禁忌も含む)】 ①過度の不安, 緊張, 興奮性のある患者 ②緑内障のある患者 ③甲状腺機能亢進のある患者 ④不整頻拍, 狭心症のある患者 ⑤本剤成分過敏症 ⑥運動性チック, Tourette 症候群の患者又はその既往歴・家族歴のある患者 ⑦重症うつ病の患者

【原則禁忌】 6 歳未満の幼児

【慎重投与】 ①てんかん又はその既往歴 ②高血圧

【併用注意】 ①昇圧剤 ② MAO 阻害剤 ③クマリン系抗凝血剤 ④抗痙攣剤 (フェノバルビタール, フェニトイン, プリミドン) ⑤三環系抗うつ剤 (イミプラミン等) ⑥グ

アネチジン ⑦アルコール

【重大な副作用】 ①剥脱性皮膚炎 ②脳動脈炎及び梗塞, 狭心症 ③悪性症候群 (Syndrome malin)

【副作用】 口渇 (32.9%), 頭痛 (14.8%), 発汗 (24.3%), 食欲減退 (16.9%), 頭痛・頭重, 注意集中困難, 神経過敏, 不眠, 眠気, 口渇, 食欲不振, 胃部不快感, 便秘, 悪心・嘔吐, 下痢, 口内炎, 心悸亢進, 不整脈, 排尿障害, 性欲減退, 発汗, 筋緊張 (5%以上)

【妊婦・授乳婦】 妊婦: 投与しないことが望ましい, 授乳婦: 授乳回避

【小児・高齢者への影響】 ① 6 歳未満の幼児には投与しないこと ② 小児に長期投与した場合, 体重増加の抑制, 成長遅延, 高齢者: 慎重投与

【特記事項】 ①重要な基本的注意 (1) 覚醒効果があるので, 不眠に注意し, 夕刻以後の服薬は原則として避けさせること (2) 連用により薬物依存を生じることがあるので, 特に薬物依存, アルコール中毒等の既往歴のある患者には慎重に投与すること (3) 自動車の運転等危険を伴う機械の操作には従事させないように注意すること ②過量投与: 主に中枢神経系の過剰刺激及び過度の交感神経興奮に起因する諸症状 (嘔吐, 激越, 振戦, 反射亢進, 筋攣縮, 痙攣, 多幸感, 錯乱, 幻覚, せん妄, 発汗, 潮紅, 頭痛, 高熱, 頻脈, 心悸亢進, 不整脈, 高血圧, 散瞳など). 症状に応じた支持療法を行う. 自己損傷の防止, 過剰刺激症状をさらに悪化させる外部刺激の排除に留意. 重篤でなく, 意識

がある場合には催吐あるいは胃洗浄によって胃内容物を除去. 重篤な場合は胃洗浄の前に短時間作用型バルビツール酸系薬剤を用量に注意し投与. 血液循環と呼吸の維持に集中治療を行う. 高熱に対しては物理的な解熱処置. リタリン過量服用に対する腹膜透析, 血液透析の有効性は確立していない

③適応外疾患 [注意欠陥多動性障害 (ADHD)] に対する投与で, 全身痙攣が報告されている ④海外において, 器質的心疾患を有する小児に対する中枢神経興奮剤 (アンフェタミン, メタンフェタミン, メチルフェニデート等) の投与例で, 突然死が報告されている

ニセルゴリン
nicergoline

サアミオン (田辺) : 錠 5mg, 散 1%

【適応 (効能・効果)】 脳梗塞後遺症に伴う慢性脳循環障害による意欲低下の改善

【用法・用量】 成人 : 1 日量 15mg, 分 3

【臨床成績】 意欲低下 : 29.9%, 精神症候 : 34.5%

【薬効薬理】 脳循環改善作用, 血液流動性改善作用, 脳エネルギー代謝改善作用, 脳神経機能改善作用, 脳波改善作用, 神経伝達系に対する作用 : 脳内コリンアセチルトランスフェラーゼ (CAT) 活性及びムスカリン性アセチルコリン受容体結合能回復, 海馬のアセチルコリン遊離回復, 脳内 AChE 活性阻害と海馬アセチルコリン量増加作用, ドーパミン代謝回転促進作用

【薬物動態】 (健康成人, 15mg) : C_{max} : 57 ~ 96ng eq./ml. Tmax : 2 ~ 4 時間

【薬物代謝】 尿中排泄率 51% (24 時間)

【禁忌】 禁忌 : 頭蓋内出血後, 止血が完成していないと考えられる患者

【副作用】 食欲不振 (0.39%), 下痢 (0.39%), 便秘 (0.29%) など

【妊婦・授乳婦】 妊婦 : 治療上の有益性 > 危険性のみ投与. 授乳禁止

【小児・高齢者】 小児等 : 安全性未確立, 高齢者 : 慎重投与 (減量)