

B. 多受容体作用薬

アセナピンマレイン酸塩

Asenapine Maleate

●シクレスト(MeijiSeika)

舌下錠：5mg, 10mg.

[特] a. ムスカリン作用は低く

5-HT_{1A}受容体刺激作用.

b. 陽性症状・陰性症状の他、認知機能、随伴症状の不安・うつ等にも効果、体重増加、代謝性パラメータ、血中プロラクチンへの影響少ない。

c. 口腔粘膜吸収・速崩性舌下錠

→経口時の初回通過効果を回避。

[効] 統合失調症。

[用] 水なしで舌下投与し

10分間は飲食しない。

はじめ5mgを1日2回舌下投与。

維持量は5mgを1日2回、

最大：1回10mgを1日2回まで。

年齢、症状に応じ適宜増減。

- ・シートから出す時につぶさない。
- ・欠けや割れは全量を舌下へ入れる。
- ・吸湿性に注意。
- ・飲み込まない。

[体内動態] a. ピークは1.25時間、

半減期は17時間

b. 未変化体は便中排泄。

c. CYP1A2の基質、CYP2D6を軽度に阻害。

d. 高脂肪朝食摂取直後に舌下投与で

AUCは21%減少、投与4時間後の食事

摂取で13%減少。服薬10分経過後に

水摂取で無影響。投与後5分、2分目の

水摂取では10%、19%低下。

[使用上の注意]→共通 868頁, 874頁。

[禁] 重度の肝機能障害でAUCが5.5倍。

[真] 1. 不整脈の既往歴、先天性QT延長、

QT延長薬投与患者→QT延長。

2. パーキンソン病又はレビー小体型

認知症→悪性症候群、錐体外路症状

の悪化、錯乱、意識レベルの低下、転倒。

[患] 妊婦：安全性確立していない。

授乳禁止。

[併]→相互作用一覧表870頁。

[副] 66% A. 重大：a. 悪性症候群、

b. 遅発性ジスキネジア、c. 肝機能障害、

d. ショック、アナフィラキシー、

e. 舌腫脹、咽頭浮腫、f. 高血糖、糖尿病性

ケトアシドーシス、糖尿病性昏睡

g. 低血糖、h. 横紋筋融解症、

i. 無顆粒球症、白血球減少、

j. 肺塞栓症、深部静脈血栓症、

k. 痙攣、l. 麻痺性イレウス。

D. 好中球減少、高プロラクチン血症、

食欲亢進、脂質異常、食欲減退、高脂血

症、体液貯留、激越、不眠、攻撃性、不安、易刺激性、気分動揺、パニック発作、落ち着きのなさ、睡眠障害、自殺念慮、錯乱状態、精神病性障害、悪夢、躁病、うつ病、●アカシジア8%、●浮動性めまい5%、●錐体外路障害6%、●傾眠12%、味覚異常、頭痛、パーキンソンニズム、鎮静、振戦、運動緩慢、構語障害、ジスキネジア、ジストニア、感覚鈍麻、失神、舌の麻痺、口下顎ジストニア、下肢静止不能症候群、調節障害、眼痛、眼球回転発作、霧視、動悸、洞性徐脈、頻脈、洞性頻脈、脚ブロック、高血圧、低血圧、起立性低血圧、胸郭及び縦隔障害、咽喉絞扼感、咽頭感覚鈍麻、●口の感覚鈍麻10%、便秘、悪心、口腔内不快感、流涎過多、嘔吐、口の錯感覚、口腔内潰瘍、腹部不快感、嚥下障害、舌痛、変色歯、口内炎、口腔粘膜水疱、肝機能異常、異汗性湿疹、そう痒、小水疱性湿疹、多汗、発疹、脱毛、顔面腫脹、尋麻疹、血管浮腫、全身性皮疹、筋固縮、筋緊張、筋骨格硬直、四肢痛、筋肉痛、関節痛、筋痙縮、筋攣縮、関節腫脹、筋力低下、遺尿、尿失禁、不規則月経、乳汁漏出症、無月経、口渴、倦怠感、無力症、胸部不快感、疲労、歩行障害、末梢性浮腫、浮腫、異常感、局所腫脹、●体重増6%、ALT↑、AST↑、血中CPK↑、γ-GTP↑、体重減、コレステロール↑、血糖↑、インスリン↑、トリグリセリド↑、QT延長、好酸球数↑、グリコヘモグロビン↑、低比重リボ蛋白↑、尿中蛋白陽性、ALP↑、心拍数↑、血圧上昇、転倒。