

東京クリニック

医薬品情報

TEL 03-5287-5532

Web <http://www.tokyo-clinic.jp>

Mail info@tokyo-clinic.jp

**2004年 8 月改訂(____ : 改訂箇所、第 3 版)
 *2002年12月改訂

日本標準商品分類番号
 871179

精神・情動安定剤
アビリット錠100
アビリット錠200
 Abilit®
 スルピリド錠

劇薬、指定医薬品、要指示医薬品^{注)}
 劇薬、指定医薬品、要指示医薬品^{注)}

	承認番号	薬価収載	販売開始
錠100mg	15400AMZ00258000	1979年 4 月	1979年 5 月
錠200mg	15400AMZ00259000	1979年 4 月	1979年 5 月

使用期限：4年(組箱、ラベルに記載)
 貯法：室温保存

禁忌(次の患者には投与しないこと)

- * (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- * (2) プロラクチン分泌性の下垂体腫瘍(プロラクチノーマ)の患者〔抗ドパミン作用によりプロラクチン分泌が促進し、病態を悪化させるおそれがある。〕
- (3) 褐色細胞腫の疑いのある患者〔急激な昇圧発作を起こすおそれがある。〕

*組成・性状

販 売 名	アビリット錠100	アビリット錠200
有効成分 (1錠中)	スルピリド 100mg	スルピリド 200mg
添 加 物	乳糖、デキストリン、メチルセルロース、カルメロース、ステアリン酸マグネシウム、カルナウバロウ、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、酸化チタン、トリアセチン	乳糖、デキストリン、メチルセルロース、カルメロース、ステアリン酸マグネシウム、カルナウバロウ、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、酸化チタン、トリアセチン
色・剤形	白色～帯黄白色のフィルムコート錠	白色～帯黄白色のフィルムコート錠
外 形		
大 き さ	直径約 7mm	直径約 9mm
識別コード	❖ 021/100	❖ 021/200

**効能・効果、用法・用量

○統合失調症

スルピリドとして、通常成人 1 日 300～600mg を分割経口投与する。
 なお年齢、症状により適宜増減するが、1 日 1200mg まで増量することができる。

○うつ病・うつ状態

スルピリドとして、通常成人 1 日 150～300mg を分割経口投与する。
 なお年齢、症状により適宜増減するが、1 日 600mg まで増量することができる。

使用上の注意

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1) 心・血管疾患、低血圧又はそれらの疑いのある患者〔症状が悪化させるおそれがある。〕
- * (2) QT 延長のある患者〔QT 延長が悪化するおそれがある。〕
- * (3) QT 延長を起こしやすい患者〔QT 延長が発現するおそれがある。〕
 - 1) 著明な徐脈のある患者
 - 2) 低カリウム血症のある患者 等
- (4) 腎障害のある患者〔高い血中濃度が持続するおそれがある。〕
- (5) パーキンソン病の患者〔錐体外路症状が悪化するおそれがある。〕
- (6) 脱水・栄養不良状態等を伴う身体的疲弊のある患者〔悪性症候群(Syndrome malin)が起こりやすい。〕
- (7) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)
- (8) 小児(「小児等への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤の投与により、**内分泌機能異常(プロラクチン値上昇)、錐体外路症状等の副作用**があらわれることがあるので、本剤の投与に際しては、有効性と安全性を十分考慮のうえ使用すること。
- (2) ときに眠気、めまい等があらわれることがあるので、本剤投与中の患者には**自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させない**よう注意すること。
- (3) 制吐作用を有するため、他の薬剤に基づく中毒、腸閉塞、脳腫瘍等による**嘔吐症状を不顕性化**することがあるので注意すること。

3. 相互作用

併用注意(併用に注意すること)

薬 剤 名 等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
*QT 延長を起こすことが知られている薬剤 チオリダジン イミプラミン ピモジド 等	QT 延長、心室性不整脈等の重篤な副作用を起こすおそれがある。	本剤及びこれらの薬剤はいずれも QT 間隔を延長させるおそれがあるため、併用により作用が増強するおそれがある。

薬 剤 名 等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ジギタリス剤 ジゴキシン ジギトキシン 等	ジギタリス剤飽和時の指標となる悪心・嘔吐、食欲不振症状を不顕性化するおそれがある。	本剤の制吐作用による。
ベンザミド系薬剤 メトクロプラミド チアプリド 等 フェノチアジン系薬剤 クロルプロマジン等 ブチロフェノン系薬剤 ハロペリドール等	内分泌機能異常、錐体外路症状が発現しやすくなる。	これらの薬剤は抗ドパミン作用を有するため、併用により抗ドパミン作用が強くなる。
中枢神経抑制剤 バルビツール酸誘導体 麻酔剤 等	相互に中枢神経抑制作用を増強させることがある。	ともに中枢神経抑制作用を有する。
ドパミン作動薬 レボドパ等	相互に作用を減弱させることがある。	本剤は抗ドパミン作用を有するため、作用が拮抗する。
アルコール (飲酒)	相互に中枢神経抑制作用を増強させることがある。	ともに中枢神経抑制作用を有する。

4. 副作用

総症例 17010 例中、副作用発現例は 2136 例で発現頻度は 12.6％であった。¹⁾(副作用頻度報告終了時：1982 年 4 月)

(1)重大な副作用

1)悪性症候群(Syndrome malin) (0.1％未満)

悪性症候群があらわれることがあるので、無動緘黙、強度の筋強剛、嚥下困難、頻脈、血圧の変動、発汗等が発現し、それに引き続き発熱がみられる場合は、投与を中止し、体冷却、水分補給等の全身管理とともに適切な処置を行うこと。本症発症時には、白血球の増加や血清CK (CPK)の上昇がみられることが多く、また、ミオグロビン尿を伴う腎機能の低下がみられることがある。

なお、高熱が持続し、意識障害、呼吸困難、循環虚脱、脱水症状、急性腎不全へと移行し、死亡した例が報告されている。

2)痙攣(0.1％未満)

痙攣があらわれることがある。このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

*3)QT 延長、心室頻拍(0.1％未満)

QT延長、心室頻拍(torsades de pointesを含む)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

*4)肝機能障害、黄疸(0.1％未満)

AST(GOT)、ALT(GPT)、γ-GTP、ALPの上昇を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

5)遅発性ジスキネジア(0.1％未満)

長期投与により、口周部等の不随意運動があらわれ、投与中止後も持続することがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。

(2)その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

	0.1～5％未満	0.1％未満
心・血管系 ※1)	血圧下降	心電図異常、血圧上昇、胸内苦悶、頻脈
錐体外路症状 ※2)	パーキンソン症候群(振戦、筋強剛、流涎等)、ジスキネジア(舌のもつれ、言語障害、頸筋捻転、眼球回転、注視痙攣、嚥下困難等)、アカシジア(静坐不能)	
内分泌 ※3)	乳汁分泌、女性化乳房、月経異常、射精不能	
精神神経系	睡眠障害、不穏、焦躁感、眠気、頭痛、頭重、めまい、浮遊感、興奮、躁転、躁状態、しびれ、運動失調	物忘れ、ぼんやり、徘徊、多動、抑制欠如、無欲状態
消化器	悪心、嘔吐、口渇、便秘、食欲不振、腹部不快感	下痢、胸やけ、腹痛、食欲亢進
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、ALP等の上昇	
皮膚 ※4)	発疹	掻痒感
眼		視力障害、眼球冷感・重感、眼のちらつき
その他 ※5)	体重増加、浮腫、脱力感、倦怠感、排尿困難、性欲減退	頻尿、腰痛、肩こり、熱感、発熱、発汗、鼻閉

※1) 急激に増量した場合、心電図に変化がみられることがあるので慎重に投与すること。
 ※2) このような症状があらわれた場合には、減量又は抗パーキンソン剤の併用等適切な処置を行うこと。
 ※3) このような症状があらわれることがあるので観察を十分に行い、慎重に投与すること。
 ※4) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。
 ※5) 浮腫があらわれた場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多く、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、副作用(錐体外路症状等)の発現に注意し、用量並びに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

(参考)

- 1)生殖試験(SD系ラット)
32mg/kgから125mg/kgまでの量を妊娠前から妊娠初期にかけて連続経口投与した実験では、性周期の休止及び妊娠率の低下が認められた。
- 2)周産期・授乳期試験(SD系ラット)
250mg/kgを周産期・授乳期に連続経口投与した実験では、軽度の出産遅延が認められた。

(2)授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。〔母乳中へ移行することが報告されている。〕(「薬物動態」の項参照)

7. 小児等への投与

小児等に対する有効性及び安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

8. 過量投与

徴候、症状：パーキンソン症候群等の錐体外路症状があらわれる。また、昏睡があらわれることもある。

処置：主として対症療法及び維持療法(輸液等)を行う。

9. 適用上の注意

薬剤交付時

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。)

10. その他の注意

(1)動物の慢性毒性実験で精巣萎縮を、また、生殖試験において妊娠率の低下を起こすとの報告がある。

(2)ラットで 40mg/kg/日以上、また、マウスで 600mg/kg/日以上を長期間経口投与した試験において、下垂体、乳腺等での腫瘍発生頻度が対照群に比し高いとの報告がある。

薬物動態

1. 吸収・排泄

健常成人に 100mg を 1 回経口投与した時の血中濃度は、2 時間後に最高値(0.31 µg/mL)に達し、8 時間後には 0.13 µg/mL を示した。また、尿中排泄率は投与 24 時間後で 23.9 % を示すことが認められている。

2. 乳汁中移行

産褥期の初産婦にスルピリド 50mg を 1 日 2 回経口投与すると、投与 2 時間後の乳汁中スルピリド濃度は 0.97 µg/mL であった。²⁾

**臨床成績

1. 統合失調症

一般臨床試験 683 例の統合失調症に対する経口剤の総合効果は、終始経口投与で 38.5 % (230/597 例)、やや有効も含めると 62.0 % (370/597 例)、筋注→経口投与では 67.4 % (58/86 例)、やや有効も含めると 83.7 % (72/86 例)で、病期別総合効果はいずれの投与方法によっても、発病初期、急性増悪期が慢性期よりまさり、病型別には妄想型、緊張型が破瓜型よりまさっていた。

2. うつ病・うつ状態

一般臨床試験 498 例(経口、筋注、筋注→経口投与例を含む)によるうつ病・うつ状態に対する総合効果は 56.2 % (280/498 例)、やや有効も含めると 77.7 % (387/498 例)であった。

薬効薬理

1. 抗精神病作用

従来の抗精神病剤にほぼ匹敵する抗アポモルヒネ作用(イヌ)及び抗ドーパミン作用(イヌ)を示す。

2. 抗うつ作用

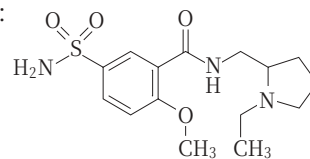
従来の三環系抗うつ剤が有する生体アミンの神経終末への取込み抑制作用は示さないが(ラット)、抗うつ作用を裏付けると考えられる抗レセルピン作用を示す(サル)。

有効成分に関する理化学的知見

一般名：スルピリド(Sulpiride)

化学名：N-(1-Ethylpyrrolidin-2-ylmethyl)-2-methoxy-5-sulfamoylbenzamide

構造式：



分子式：C₁₅H₂₃N₃O₄S (341.43)

性状：白色の結晶性の粉末で、においはない。

酢酸(100)又は希酢酸に溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール(95)又はアセトンに溶けにくく、水、クロロホルム又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

希塩酸又は 0.05mol/L 硫酸試液に溶ける。

融点：175～182℃(分解)

包装

アビリット錠 100：PTP100 錠(10 錠×10)、1000 錠、PTP1000 錠(10 錠×100)

アビリット錠 200：PTP100 錠(10 錠×10)、1000 錠、PTP1000 錠(10 錠×100)

主要文献

1) 医薬品副作用情報 No.61, 1983年6月。

2) Aono, T. et al. : J. Clin. Endocrinol. Metab., 48(3) : 478, 1979.

**製品に関するお問い合わせ先

住友製薬株式会社 くすり情報センター
TEL 0120-03-4389

文献請求先

住友製薬株式会社 医薬情報部
大阪市中央区道修町2丁目2番8号(〒541-8510)

製造発売元

住友製薬株式会社

大阪市中央区道修町2丁目2番8号

