

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

規制区分

劇薬、指定医薬品、
要指示医薬品
(注意—医師等の処方せん・
指示により使用すること)

精神安定剤

ルバトレン錠

Luvatren®

塩酸モペロン

承認番号	46AM輸-46
薬価収載	1972年2月
販売開始	1971年8月

使用期限 外箱等の表示を参照

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (1)昏睡状態の患者[昏睡状態が悪化するおそれがある。]
- (2)バルビツール酸誘導体等の中枢神経抑制剤の強い影響下にある患者[本剤の作用が過度にあらわれることがある。]
- (3)重症の心不全患者[症状を悪化させるおそれがある。]
- (4)パーキンソン病のある患者[症状を悪化させるおそれがある。]
- (5)ブチロフェノン系化合物に対し過敏症の患者
- (6)エピネフリンを投与中の患者[「相互作用」の項参照]
- (7)テルフェナジン又はアステミゾールを投与中の患者[「相互作用」の項参照]

**【組成・性状】

販売名	有効成分 (1錠中)	外形 (mm)	重量 (g)	色調	識別 コード
ルバトレン錠	塩酸モペロン 5mg	 錠剤 直径: 6.0 厚さ: 2.7	0.08	淡茶 白色	YS 703

添加物: 乳糖、カンテン末、ポビドン、カカオ末、タルク、ステアリン酸マグネシウム

【効能・効果】

統合失調症

【用法・用量】

通常、初期1日2～3錠より投与を始め、症状に応じ漸増し、1日4～6錠を症状が改善するまで継続投与する。一般に維持量は1日2～3錠である。

なお、年齢・症状により適宜増減する。

【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)肝障害のある患者[血中濃度が上昇するおそれがある。]
- (2)心・血管疾患、低血圧、又はそれらの疑いのある患者[一過性の血圧低下があらわれることがある。]
- (3)てんかん等の痙攣性疾患、又はこれらの既往歴のある患者[痙攣閾値を低下させることがある。]
- (4)高齢者[「高齢者への投与」の項参照]
- (5)小児[「小児等への投与」の項参照]
- (6)薬物過敏症の患者

2. 重要な基本的注意

眠気、注意力・集中力・反射運動能力等の低下が起こることがあるので、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. 相互作用

【併用禁忌】(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
エピネフリン	エピネフリンの作用を逆転させ、血圧降下を起こすことがある。	エピネフリンはアドレナリン作動性 α 、 β -受容体の刺激剤であり、本剤の α -受容体遮断作用により β -受容体刺激作用が優位となり、血圧降下作用が増強される可能性がある。
テルフェナジン アステミゾール	QT延長、心室性不整脈を起こすおそれがある。	機序不明

【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
中枢神経抑制剤 バルビツール酸 誘導体 等	相互に作用を増強することがあるので、用量を調節するなど注意すること。	薬理学的な相加作用(中枢神経抑制作用)によると考えられている。
アルコール(飲酒)	相互に作用を増強することがある。	アルコールの中枢神経抑制作用に基づくと考えられている。

4. 副作用

承認時及び承認後の調査症例3,261例中、本剤との関連が疑われる副作用発現症例は861例(26.4%)であった。副作用の内訳は、パーキンソン症状(113例、3.5%)、手指振戦(89例、2.7%)、アカシジア(32例、1.0%)等の錐体外路系症状、不眠(100例、3.1%)、口渇(78例、2.4%)、焦躁感(69例、2.1%)、眠気(52例、1.6%)等の精神神経系症状、食欲不振(30例、0.9%)、悪心(19例、0.6%)、便秘(16例、0.5%)等の消化器系症状等が主なもので、抗精神病薬に共通して認められたものであった。また、AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇、ウロビリノーゲン陽性、倦怠・疲労感、鼻閉等の発現が報告されている。

(1)重大な副作用

Syndrome malin：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には、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、他のブチロフェノン系化合物の投与により高熱が持続し、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)その他の副作用

	5%以上	5%未満	頻度不明
循環器		血圧上昇、血圧降下、頻脈	心電図変化(QT間隔の延長、T波の変化等) ^{注1)}
肝臓		肝障害 ^{注2)}	
錐体外路症状	パーキンソン症候群(手指振戦、筋強剛、流涎等)、アカシジア(静坐不能)	ジスキネジア(痙攣性斜頸、顔面及び頸部の攣縮、後弓反射、眼球回転発作等)、長期投与により口周部の不随意運動	
感覚器		眼の調節障害	長期又は大量投与による角膜・水晶体の混濁、角膜等の色素沈着
過敏症			発疹、痒痒感 ^{注3)}
消化器		腸管麻痺(食欲不振、悪心・嘔吐、著しい便秘、腹部の膨満あるいは弛緩及び腸内容物のうっ滞等の症状) ^{注3)} 、食欲不振、悪心・嘔吐、便秘、腹痛等	
内分泌		体重増加等	
精神・神経系	不眠、焦躁感	眠気、眩暈、頭痛・頭重、興奮、言語障害等	
その他		口渇、鼻閉、倦怠感、発熱、発汗、排尿障害	

注1)観察を十分に行い、異常が認められた場合には減量又は投与を中止すること。

注2)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すること。

注3)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. 高齢者への投与

高齢者では、少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。
[錐体外路症状等の副作用が発現しやすい。]

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦、妊娠している可能性のある婦人又は授乳婦には投与しないことが望ましい。[他のブチロフェノン系化合物による動物実験で胎児吸収、流産等の胎児毒性が、また、乳汁中への移行が報告されている。]

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

8. 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、更には穿孔をお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。]

9. その他の注意

(1)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。

(2)他のブチロフェノン系化合物による治療中、原因不明の突然死が報告されている。

〔臨床成績〕

総症例212例について、比較試験を含む臨床試験が国内で実施された。このうち統合失調症は203例で、有効率は、43.8%(89/203)であった。なお、ペルフェナジンを対照薬とした比較試験で本剤の有用性が認められている¹⁾。

〔薬効薬理〕

中枢神経抑制作用

塩酸モペロンは、マウス、ラットにおける皮下注射の実験で、クロロプロマジンに比し強力な抗アンフェタミン作用、抗アポモルヒネ作用、麻酔睡眠増強作用、条件反射抑制作用を示し、ハロペリドールと質的に同様の作用を示すことが認められている²⁻⁴⁾。

〔有効成分に関する理化学的知見〕

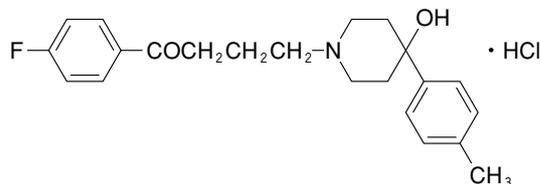
一般名：塩酸モペロン(Moperone Hydrochloride)

化学名：4-fluoro-4'-(4-hydroxy-4-p-tolyl)piperidino)-butyrophenone hydrochloride

分子式：C₂₂H₂₆FNO₂・HCl

分子量：391.91

構造式：



性状：本品は、白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはない。本品は氷酢酸又はメタノールに溶けやすく、クロロホルムにやや溶けやすく、水又はエタノールにやや溶けにくく、エーテルにはほとんど溶けない。本品の水溶液(1→250)は微酸性である。

〔包 装〕

ルバトレン錠 500錠(PTP)、1000錠(バラ)

〔主要文献及び文献請求先〕

<主要文献>

- 1) 伊藤 斉 他：精神医学. 11:131, 1969.
- 2) Janssen, P. A. J. et al. : J. Med. Pharm. Chem. 1 :281, 1959.
- 3) Janssen, P. A. J. et al. : Arzneimittel-Forsch. 15:104, 1965.
- 4) 岩垂正矩 他：基礎と臨床. 4:869, 1970.

**<文献請求先・製品情報お問い合わせ先>

山之内製薬株式会社 製品情報センター
〒174-8612 東京都板橋区蓮根3-17-1
電話 (03) 5916-5195

* 製造発売元 **山之内製薬株式会社**
本社 東京都中央区日本橋本町2-3-11 〒103-8411

