



\* 2019年6月改訂(第7版)  
\* 2015年11月改訂  
貯法：錠1mgは遮光・室温保存、  
細粒1%は気密容器・室温保存  
使用期限：外箱等に記載

|            |
|------------|
| 日本標準商品分類番号 |
| 871162     |

抗パーキンソン剤

処方箋医薬品<sup>注)</sup>

# アキネトン<sup>®</sup>錠1mg

# アキネトン<sup>®</sup>細粒1%

<ピペリデン塩酸塩製剤>

## AKINETON<sup>®</sup>

|      |               |         |          |
|------|---------------|---------|----------|
|      | 承認番号          | 薬価収載    | 販売開始     |
| 錠1mg | 21900AMX00772 | 2007年6月 | 1964年6月  |
| 細粒1% | 21900AMX00773 | 2007年6月 | 1981年11月 |

再評価結果 1977年10月

◎登録商標

注) 注意 - 医師等の処方箋により使用すること

### 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- \*\* (1)閉塞隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。〕  
(2)本剤の成分に対し過敏症の患者  
(3)重症筋無力症の患者〔本剤の抗コリン作用により症状が悪化するおそれがある。〕

### 組成・性状

|       |   |        |       |                 |
|-------|---|--------|-------|-----------------|
| 販売名   | アキネトン錠1mg                                   |        |       | アキネトン細粒1%       |
| 成分・含量 | 1錠中ピペリデン塩酸塩1mg                              |        |       | 1g中ピペリデン塩酸塩10mg |
| 添加物   | 結晶セルロース、トウモロコシデンプン、硬化油、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム |        |       | 乳糖水和物、軽質無水ケイ酸   |
| 剤形    | 白色の割線入り素錠                                   |        |       | 白色の細粒           |
| 外形    |   |        |       | _____           |
| 大きさ   | 直径(mm)                                      | 厚さ(mm) | 重さ(g) | _____           |
|       | 7.0   | 2.1    | 0.10  |                 |
| 識別コード | P135  |        |       | _____           |

### 効能・効果

特発性パーキンソニズム

その他のパーキンソニズム(脳炎後、動脈硬化性、中毒性) 向精神薬投与によるパーキンソニズム・ジスキネジア(遅発性を除く)・アカシジア

#### 【効能・効果に関連する使用上の注意】

抗パーキンソン剤はフェノチアジン系薬剤、ブチロフェノン系薬剤、レセルピン誘導体等による口周部等の不随意運動(遅発性ジスキネジア)を通常軽減しない。

場合によっては、このような症状を増悪顕性化させることがある。

### 用法・用量

ピペリデン塩酸塩として、通常成人1回1mg(細粒は0.1g、錠は1錠)1日2回よりはじめ、その後漸増し、1日3～6mg(細粒は0.3～0.6g、錠は3～6錠)を分割経口投与する。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)開放隅角緑内障の患者〔抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。〕  
(2)前立腺肥大など尿路に閉塞性疾患のある患者〔排尿障害が発現又は悪化することがある。〕  
(3)胃腸管に閉塞性疾患のある患者〔腸管麻痺が発現又は悪化するおそれがある。〕

- (4)不整脈又は頻拍傾向のある患者〔不整脈等の循環器系の副作用を起すおそれがある。〕  
(5)肝又は腎障害のある患者〔代謝・排泄機能が低下しているため、副作用が起りやすい。〕  
(6)高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕  
(7)てんかんの患者〔発作の誘因となるおそれがある。〕  
(8)高温環境にある患者〔発汗抑制が起りやすい。〕  
(9)動脈硬化性パーキンソン症候群の患者〔精神神経系の副作用が起りやすい。〕  
(10)脱水・栄養不良状態等を伴う身体的疲弊のある患者〔Syndrome malin (悪性症候群)が起りやすい。〕

### 2. 重要な基本的注意

- (1)本剤の投与は、少量から開始し、観察を十分に行い、慎重に維持量まで増量すること。また、他剤から本剤に切り替える場合には、他剤を徐々に減量しながら本剤を増量するのが原則である。  
(2)本剤投与中は定期的に隅角検査及び眼圧検査を行うことが望ましい。  
(3)本剤の大量投与により、パーキンソン症状の増悪がみられることがあるので、このような場合には減量するなど適切な処置を行うこと。  
(4)眠気、調節障害及び注意力・集中力・反射機能等の低下が起ることがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転など危険を伴う機械の操作には従事させないよう注意すること。

### 3. 相互作用

#### 併用注意(併用に注意すること)

| 薬剤名   | 臨床症状・措置方法  | 機序・危険因子                     |
|---|--|-----------------------------|
| 抗コリン作用を有する薬剤<br>フェノチアジン系薬剤<br>ブチロフェノン系薬剤<br>三環系抗うつ剤等            | 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)をきたし、麻痺性イレウスに移行することがあるので、腸管麻痺があらわれた場合には投与を中止すること。<br>なお、この悪心・嘔吐はフェノチアジン系薬剤等の制吐作用により不顕性化することもある。注意すること。 | 併用により抗コリン作用が強くなる。           |
| 中枢神経抑制剤<br>バルビツール酸誘導体<br>フェノチアジン系薬剤<br>三環系抗うつ剤<br>モノアミン酸化酵素阻害剤等 | 眠気、精神運動機能低下、幻覚、妄想等があらわれることがあるので、減量するなど注意すること。  | 併用により中枢神経抑制作用又は抗コリン作用が強くなる。 |

| 薬剤名                                      | 臨床症状・措置方法                   | 機序・危険因子                         |
|--|-----------------------------|---------------------------------|
| 他の抗パーキンソン剤<br>レボドパ<br>アマタジン<br>プロモクリプチン等 | 幻覚、妄想等の精神神経系の副作用が増強することがある。 | ドパミン過剰及びアセチルコリン系神経機能低下が考えられている。 |

#### 4. 副作用

本剤は副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

##### (1) 重大な副作用

###### 1) Syndrome malin(悪性症候群)

抗精神病薬、抗うつ剤及びドパミン作動系抗パーキンソン剤との併用において、本剤及び併用薬の減量又は中止により、発熱、無動緘黙、意識障害、強度の筋強剛、不随意運動、嚥下困難、頻脈、血圧の変動、発汗等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、体冷却、水分補給等の全身管理及び本剤の投与量を一旦もとに戻した後慎重に漸減するなどの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)の上昇があらわれることが多く、また、ミオグロビン尿を伴う腎機能の低下があらわれることがある。

###### 2) 依存性

本剤により気分高揚等が出現したとする報告があり、依存形成につながるおそれがあるので、観察を十分にを行い、慎重に投与すること。

##### (2) その他の副作用

| 分類            | 頻度不明                          |
|---------------|-------------------------------|
| 精神神経系<br>(注1) | 幻覚、せん妄、精神錯乱、不安、嗜眠、記憶障害        |
| 消化器           | 口渇、悪心、嘔吐、食欲不振、胃部不快感、下痢、便秘、口内炎 |
| 泌尿器           | 排尿困難、尿閉                       |
| 過敏症<br>(注2)   | 発疹                            |
| 循環器           | 血圧低下、血圧上昇                     |
| 眼             | 眼の調節障害                        |
| 肝臓<br>(注3)    | 肝障害                           |

注1：異常が認められた場合には、減量又は休薬するなど適切な処置を行うこと。

注2：異常が認められた場合には投与を中止すること。

注3：異常が認められた場合には、減量又は中止するなど適切な処置を行うこと。投与中は定期的に肝機能検査を行うことが望ましい。

#### 5. 高齢者への投与

高齢者では、慎重に投与すること。〔せん妄、不安等の精神症状及び抗コリン作用による口渇、排尿困難、便秘等があらわれやすい。〕

#### 6. 妊婦・産婦・授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び授乳中の婦人には、投与しないことが望ましい。〔妊娠中及び授乳中の投与に関する安全性は確立していない。〕

#### 7. 小児等への投与

小児等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。〔小児等に対する安全性は確立していない。〕

#### 8. 過量投与

**症状** 主な症状は抗コリン作用に基づくものである。口渇、体温上昇、頻脈、不整脈、尿閉、興奮、幻覚、妄想、錯乱、痙れん、呼吸抑制等があらわれることがある。

**処置** 中枢神経興奮症状に対してはジアゼパム、短時間作用型の

バルビツール酸系薬剤の投与を行う。抗コリン作用を有する抗精神病薬は症状を悪化させることがあるので投与しないこと。

#### 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。〕

#### ■薬物動態

##### 血漿中濃度<sup>1)</sup>

〔健康成人(外国人)、4mg 1回経口投与〕

| Tmax(h) | Cmax(ng/mL) | t <sub>1/2</sub> β (h) |
|---------|-------------|------------------------|
| 1.5     | 5.1         | 18.4                   |

#### ■臨床成績

経口投与による156例についての臨床成績<sup>2-4)</sup>は次のとおりである。

| 対象疾患                            | 有効率        |
|---------------------------------|------------|
| 特発性パーキンソニズム                     | 92%(23/25) |
| 向精神薬投与によるパーキンソニズム               | 74%(63/85) |
| その他のパーキンソニズム<br>(脳炎後、動脈硬化性、中毒性) | 54%(25/46) |

#### ■薬効薬理

##### 1. 抗振戦作用

マウスのハルミン投与による振戦に対し、腹腔内投与でのED<sub>50</sub>は10.3mg/kgであり、アトロピン(ED<sub>50</sub>:28.3mg/kg)よりも強い<sup>5)</sup>。また、マウスのトレモリン投与による振戦に対し、腹腔内投与でのED<sub>50</sub>は2.7mg/kgであり、プロメタジン(ED<sub>50</sub>:5.4mg/kg)よりも強い<sup>6)</sup>。

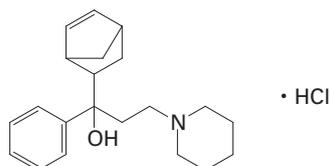
##### 2. 抗硬直作用<sup>7)</sup>

レセルピン投与によるラットの筋の緊張性活性(筋電図)についての検討で、5mg/kg 静脈内投与によりレセルピン硬直を抑制し、α及びγ反射活性を正常位に回復させる。

##### 3. 抗カタレプシー作用

ラットのベルフェナジン投与によるカタレプシーに対し、2mg/kg 腹腔内投与により、投与1時間後で80%以上の抑制を示し、その作用はトリヘキシフェニジルと同等である<sup>8)</sup>。また、ラットのプロクロロールベラジン投与によるカタレプシーに対し、腹腔内投与でのED<sub>50</sub>は1.8mg/kgであり、トリヘキシフェニジル(ED<sub>50</sub>:8mg/kg)よりも強い<sup>9)</sup>。

#### ■有効成分に関する理化学的知見



一般名：ピペリデン塩酸塩 Biperiden Hydrochloride

化学名：1-(Bicyclo[2.2.1]hept-5-en-2-yl)-1-phenyl-3-(piperidin-1-yl)propan-1-ol monohydrochloride

分子式：C<sub>21</sub>H<sub>29</sub>NO · HCl

分子量：347.92

融点：約270℃(分解)

性状：白色～帯褐黄白色の結晶性の粉末である。ギ酸に溶けやすく、水、メタノール又はエタノール(95)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

#### ■包装

アキネトン錠1mg：〔PTP〕100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

〔バラ〕1,000錠、5,000錠

アキネトン細粒1%：〔バラ〕100g、500g

#### ■主要文献

1)Hollmann, M., et al.: Eur. J. Clin. Pharmacol., 27: 619, 1984

2)森 温理, ほか: 脳と神経, 16: 789, 1964

- 3)菊地 潤,ほか：診療と新薬, 2：477, 1965  
4)大江 覚,ほか：臨牀と研究, 42：791, 1965  
5)Zetler, G.：Arch. exp. Pathol. Pharmacol., 231：34, 1957  
6)Nose, T. & Kojima, M.：Eur. J. Pharmacol., 10：83, 1970  
7)Jurna, I.：Naunyn-Schmiedebergs Arch. Pharmacol. exp. Pathol., 259：181, 1968  
8)Morpurgo, C.：Arch. Int. Pharmacodyn., 137：84, 1962  
9)Boissier, J. R. & Simon, P.：Comp. Rend. Soc. Biol., 158：2025, 1964

■文献請求先、製品に関するお問い合わせ先

大日本住友製薬株式会社

〒541-0045 大阪市中央区道修町2-6-8

くすり情報センター

**TEL 0120-034-389**

製造販売元

**大日本住友製薬株式会社**

大阪市中央区道修町2-6-8

\*提携

**マイランN.V.グループ**

